

## Bibliographic Fields

## Document Identity

(19)【発行国】

日本国特許庁(JP)

(12)【公報種別】

公開特許公報(A)

(11)【公開番号】

特開2002-322007(P2002-322007  
A)

(43)【公開日】

平成14年11月8日(2002. 11. 8)

(19) [Publication Office]

Japan Patent Office (JP)

(12) [Kind of Document]

Unexamined Patent Publication (A)

(11) [Publication Number of Unexamined Application]

Japan Unexamined Patent Publication 2002- 322007 (P2002-  
322007A)

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

Heisei 14\*November 8\* (2002.11.8)

## Public Availability

(43)【公開日】

平成14年11月8日(2002. 11. 8)

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

Heisei 14\*November 8\* (2002.11.8)

## Technical

(54)【発明の名称】

有機ホウ素化合物を含有する植物用殺線虫剤

(54) [Title of Invention]

NEMATICIDE FOR PLANT WHICH CONTAINS  
ORGANOBORON COMPOUND

(51)【国際特許分類第7版】

A01N 55/08

// C07F 5/02

【FI】

A01N 55/08

C07F 5/02 D

【請求項の数】

8

【出願形態】

OL

【全頁数】

48

【テーマコード(参考)】

4H0114H048

【Fターム(参考)】

4H011 AC01 BA01 BB16 BC03 BC19 BC20  
DA02 DC05 DC06 DC08 DC10 DH10 4H048  
AA03 AB02 VA20 VA22 VA32 VA75 VA77  
VB10

(51) [International Patent Classification, 7th Edition]

A01N 55/08

// C07F 5/02

[FI]

A01N 55/08

C07F 5/02 D

[Number of Claims]

8

[Form of Application]

OL

[Number of Pages in Document]

48

[Theme Code (For Reference)]

4H0114H048

[F Term (For Reference)]

4H011 AC01 BA 01 BB16 BC 03 BC 19 BC 20 DA02 DC05  
DC06 DC08 DC10 DH10 4H048 AA03 AB02 VA 20 VA 22  
VA 32 VA 75 VA 77 VB10

## Filing

【審査請求】

[Request for Examination]

未請求

Unrequested

(21)【出願番号】

(21) [Application Number]

特願2001-131934(P2001-131934)

Japan Patent Application 2001- 131934 (P2001- 131934)

(22)【出願日】

(22) [Application Date]

平成13年4月27日(2001. 4. 27)

Heisei 13\*April 27\* (2001.4.27)

## Parties

## Applicants

(71)【出願人】

(71) [Applicant]

【識別番号】

[Identification Number]

000001926

000001926

【氏名又は名称】

[Name]

塩野義製薬株式会社

SHIONOGI &amp; AMP; CO. LTD. (DB 69-054-0711)

【住所又は居所】

[Address]

大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号

Osaka Prefecture Osaka City Chuo-ku Doshu-cho 3-1-8

(71)【出願人】

(71) [Applicant]

【識別番号】

[Identification Number]

000227342

000227342

【氏名又は名称】

[Name]

日東化成株式会社

NITTO KASEI K.K. (DB 69-059-2407)

【住所又は居所】

[Address]

大阪府大阪市東淀川区西淡路3丁目17番14号

Osaka Prefecture Osaka City Higashi Yodogawa-ku  
Nishiawaji 3-17-14

## Inventors

(72)【発明者】

(72) [Inventor]

【氏名】

[Name]

大羽 克明

\*\* Katsuaki

【住所又は居所】

[Address]

滋賀県甲賀郡甲賀町大字五反田1405番地  
塩野義製薬株式会社内Shiga Prefecture Koka-gun shell \*\*Oaza \*Handa 1405address  
Shionogi & Co. Ltd. (DB 69-054-0711) \*

(72)【発明者】

(72) [Inventor]

【氏名】

[Name]

早瀬 善男

Hayase \*\*

【住所又は居所】

[Address]

滋賀県甲賀郡甲賀町大字五反田1405番地

Shiga Prefecture Koka-gun shell \*\*Oaza \*Handa 1405address

塩野義製薬株式会社内

Shionogi &amp; Co. Ltd. (DB 69-054-0711) \*

## Agents

(74)【代理人】

(74) [Attorney(s) Representing All Applicants]

【識別番号】

[Identification Number]

100062144

100062144

【弁理士】

[Patent Attorney]

【氏名又は名称】

[Name]

青山 葆 (外2名)

Aoyama Tamotsu (2 others)

## Abstract

(57)【要約】

(57) [Abstract]

【課題】

[Problems to be Solved by the Invention]

有機ホウ素化合物を含有する植物用殺線虫用組成物を提供する。

composition for nematocide of plant which contains organoboron compound is offered.

【解決手段】

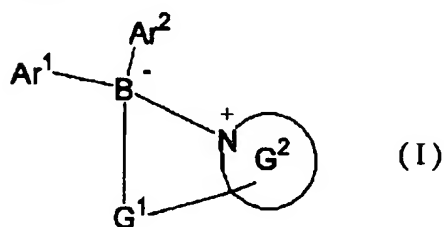
[Means to Solve the Problems]

本発明は、一般式(I):

As for this invention, General Formula (I):

【化 1】

[Chemical Formula 1]



[式中、Ar<sup>1</sup>および Ar<sup>2</sup>はそれぞれ独立して置換されていてもよい環式基;G<sup>1</sup>は、式:-A-、-A-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>-または-A-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-で表される;G<sup>2</sup>は置換されていてもよいアザ環式基(ただし、環内窒素は B<sup>-</sup>と結合している)等;なお、B<sup>-</sup>、G<sup>1</sup>および G<sup>2</sup>から構成される環は5員環または6員環である]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する植物用殺線虫剤に関する。

compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> becoming independent respectively, as for optionally substitutable cyclic group ;G<sup>1</sup>, it is displayed with formula:-A-, -A-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- or-A-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-, furthermore; as for G<sup>2</sup> optionally substitutable aza cyclic group (However, as for endocyclic nitrogen connecting with B<sup>-</sup>, it is ) etc., from the B<sup>-</sup>, G<sup>1</sup> and G<sup>2</sup> ring which configuration is done 5 -member ring or 6-member ring , it is ] or it regards nematocide for plant which contains those solvent affinitive substance .

## Claims

【特許請求の範囲】

[Claim(s)]

【請求項 1】

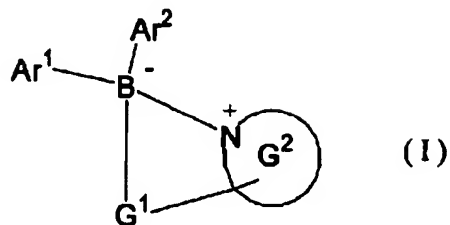
[Claim 1]

一般式(I):

General Formula (I):

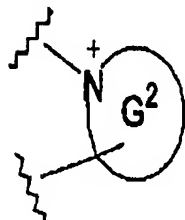
【化 1】

[Chemical Formula 1]



[式中、Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基; G<sup>1</sup> は、式  $-A-$ 、 $-A-CR^1R^2-$  または  $-A-CR^3R^4-CR^5R^6-$  で表される基(式中、A は酸素原子または硫黄原子、R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい脂肪族炭化水素基、-O-(置換されていてもよい脂肪族炭化水素基)、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> と R<sup>4</sup> および/もしくは R<sup>5</sup> と R<sup>6</sup> が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する); 式:]

【化 2】



で示される基は置換されていてもよいアザ環式基;ただし、B、G<sup>1</sup> および G<sup>2</sup> から構成される環のうち最小環は 5 員環または 6 員環であるものとする]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する植物用殺線虫剤。

【請求項 2】

一般式(I)中、Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> が同一であり、ともに置換されていてもよいアリール基である請求項 1 記載の植物用殺線虫剤。

【請求項 3】

[In Formula, as for Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> becoming independent respectively, as for optionally substitutable cyclic group; G<sup>1</sup>, formula:  $-A-$ ,  $-A-CR^{1/2}-$  or group which is displayed with  $-A-CR^{3/4}-CR^{5/6}-$  (In Formula, as for A as for oxygen atom or sulfur atom, R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> respective identical or different hydrogen atom, halogen atom, hydroxyl group, optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group, -O- (optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group), it is a acyloxy, optionally substitutable phenyl oxy, optionally substitutable amino group, optionally substitutable sulfo group, or a optionally substitutable aryl group, or or R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> and/or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> become simultaneous and form oxo, optionally substitutable methylene or the optionally substitutable imino); formula:]

[Chemical Formula 2]

So as for group which is shown as for inside minimum ring of thering which configuration is done 5 -member ring or 6-member ring are from optionally substitutable aza cyclic group; however the B, G<sup>1</sup> and G<sup>2</sup> with compound or its salt which is displayed or nematocide . for plant which contains those solvent affinitive substance

[Claim 2]

In General Formula (I), Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> being same, nematocide . for plant which is stated in Claim 1 which is a optionally substitutable aryl group together

[Claim 3]

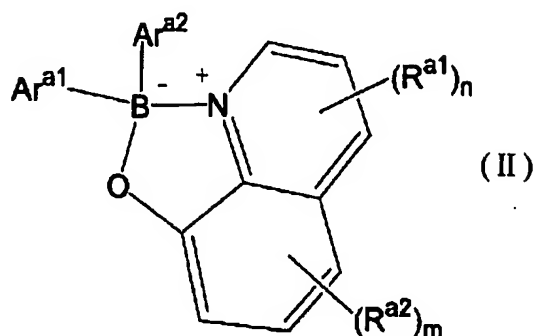


一般式(I)中、 $G^1$  が式:  $-O-$ 、 $-O-CR^1R^2-$  または  $-O-CR^3R^4-CR^5R^6-$  で表される基 (式中、 $R^1-R^6$  はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキルオキシ基、または置換されていてもよい低級アルケニルオキシ基)である請求項 1 または 2 記載の植物用殺線虫剤。

【請求項 4】

一般式(II):

【化 3】



[式中、 $Ar^{a1}$  は、置換されていてもよいアリール基; $Ar^{a2}$  は置換されていてもよい縮合アリール基; $R^{a1}$  および  $R^{a2}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基; $n$  および  $m$  は同一または異なって 0~3 のいずれかの整数を示す]で表される化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する、請求項 1 記載の植物用殺線虫剤。

【請求項 5】

一般式(III):

【化 4】

In General Formula (I),  $G^{sup>1</sup>}$  formula:  $-O-$ ,  $-O-CR^{sup>1</sup>}R^{sup>2</sup>}-$  or nematicide . for plant which is stated in Claim 1 or 2 which is a group (In Formula, as for  $R^{sup>1</sup>}$ ~ $R^{sup>6</sup>}$  respective identical or different hydrogen atom, halogen atom, hydroxyl group, optionally substitutable lower alkyl group, optionally substitutable lower alkenyl group, optionally substitutable lower alkyloxy group, or optionally substitutable lower alkenyl oxy group) which is displayed with  $-O-CR^{sup>3</sup>}R^{sup>4</sup>}-CR^{sup>5</sup>}R^{sup>6</sup>}-$

[Claim 4]

General Formula (II):

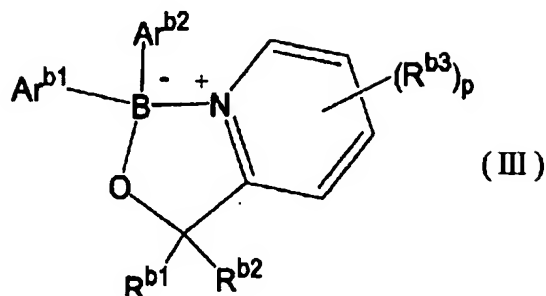
[Chemical Formula 3]

nematicide . for plant which compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for  $Ar^{sup>a1</sup>}$ , as for optionally substitutable aryl group ; $Ar^{sup>a2</sup>}$  as for optionally substitutable condensed aryl group ; $R^{sup>a1</sup>}$  and  $R^{sup>a2</sup>}$  becoming independent respectively, as for hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, halogenated lower alkyl group, halogenation lower alkenyl group, optionally substitutable aralkyl group, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, halogenation lower alkoxy group, halogenation lower alkenyl oxy group, acyloxy, optionally substitutable phenyl oxy, optionally substitutable aralkyloxy, optionally substitutable amino group, optionally substitutable sulfo group, or the optionally substitutable aryl group ; $n$  and  $m$  integer of any of identical or different 0~3 it shows ]or contains those solvent affinitive substance, states in Claim 1

[Claim 5]

general formula (III):

[Chemical Formula 4]



[式中、 $\text{Ar}^{\text{b1}}$  および  $\text{Ar}^{\text{b2}}$  は同一または異なって置換されていてもよいアリール基; $\text{R}^{\text{b1}}$  および  $\text{R}^{\text{b2}}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または  $\text{R}^{\text{b1}}$  と  $\text{R}^{\text{b2}}$  が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する; $\text{R}^{\text{b3}}$  はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒に縮合環を形成していてもよい; $p$  は 0~4 のいずれかの整数を示す]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含む、請求項 1 記載の植物用殺線虫剤。

【請求項 6】

一般式(IV):

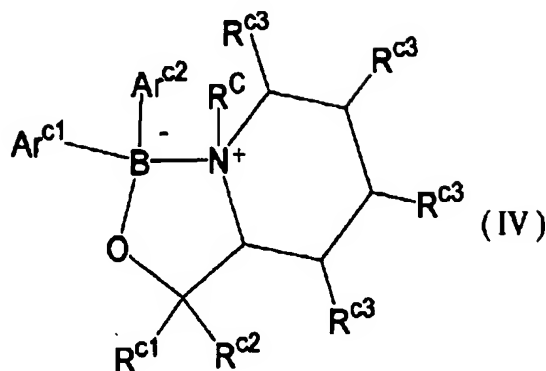
【化 5】

nematicide . for plant which compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for  $\text{Ar}^{\text{b1}}$  and  $\text{Ar}^{\text{b2}}$  as for identical or different optionally substitutable aryl group ; $\text{R}^{\text{b1}}$  and the  $\text{R}^{\text{b2}}$  becoming independent respectively, it is a hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or a optionally substitutable aryl group , or or  $\text{R}^{\text{b1}}$  and  $\text{R}^{\text{b2}}$  become simultaneous and form oxo , optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino ;  $\text{R}^{\text{b3}}$  becoming independent respectively, is halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or the optionally substitutable aryl group , or or is possible to form adjacent group and it becomes simultaneous and fused ring ;  $p$  shows integer of any 0 - 4 ] or contains those solvent affinitive substance , states in Claim 1

[Claim 6]

General Formula (IV ):

[Chemical Formula 5]



[式中、Ar<sup>c1</sup> および Ar<sup>c2</sup> はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基; R<sup>c1</sup> および R<sup>c2</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R<sup>c1</sup> と R<sup>c2</sup> が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する; R<sup>c3</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒に縮合環を形成していてもよい; R<sup>c</sup> は水素原子または低級アルキルを示す]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する、請求項1記載の植物用殺線虫剤。

## 【請求項7】

一般式(V):

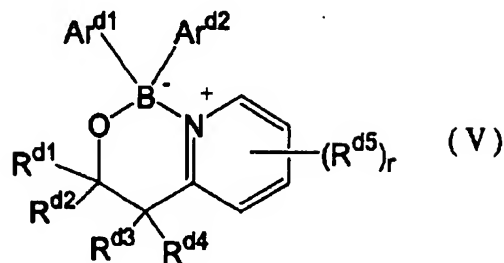
## 【化6】

nematicide . for plant which compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for Ar<sup>c1</sup> and Ar<sup>c2</sup> becoming independent respectively, as for optionally substitutable cyclic group ; R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> becoming independent respectively, it is a hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or a optionally substitutable aryl group , or or R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> become simultaneous and form oxo , optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino ; R<sup>c3</sup> becoming independent respectively, is hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or the optionally substitutable aryl group , or or is possible to form adjacent group and it becomes simultaneous and fused ring ; R<sup>c</sup> shows hydrogen atom or lower alkyl ] or contains those solvent affinitive substance , states in Claim 1

## 【Claim 7】

General Formula (V):

## 【Chemical Formula 6】



[式中、 $\text{Ar}^{\text{d1}}$  および  $\text{Ar}^{\text{d2}}$  は同一または異なって置換されていてもよいアリール基、 $\text{R}^{\text{d1}}$ 、 $\text{R}^{\text{d2}}$ 、 $\text{R}^{\text{d3}}$  および  $\text{R}^{\text{d4}}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または  $\text{R}^{\text{d1}}$  と  $\text{R}^{\text{d2}}$  および/または  $\text{R}^{\text{d3}}$  と  $\text{R}^{\text{d4}}$  が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する、 $\text{R}^{\text{d5}}$  はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒に縮合環を形成していてもよい、 $r$  は 0-4 のいずれかの整数を示す]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する、請求項 1 記載の植物用殺線虫剤。

【請求項 8】

一般式(VI):

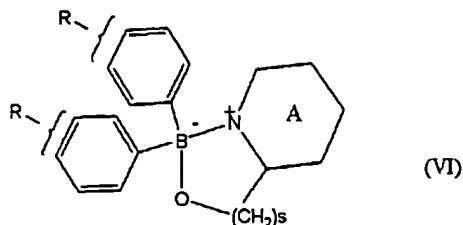
【化 7】

nematicide . for plant which compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for  $\text{Ar}^{\text{d1}}$  and  $\text{Ar}^{\text{d2}}$  as for identical or different optionally substitutable aryl group ;  $\text{R}^{\text{d1}}$ ,  $\text{R}^{\text{d2}}$ ,  $\text{R}^{\text{d3}}$  and the  $\text{R}^{\text{d4}}$  becoming independent respectively, it is a hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or a optionally substitutable aryl group , or or  $\text{R}^{\text{d1}}$  and  $\text{R}^{\text{d2}}$  and/or  $\text{R}^{\text{d3}}$  and  $\text{R}^{\text{d4}}$  become simultaneous and form oxo , optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino ;  $\text{R}^{\text{d5}}$  becoming independent respectively, is halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or the optionally substitutable aryl group , or or is possible to form adjacent group and it becomes simultaneous and fused ring ;  $r$  shows integer of any 0 - 4 ] or contains those solvent affinitive substance , states in Claim 1

【Claim 8】

General Formula (VI):

【Chemical Formula 7】



[式中、R はメタ位またはパラ位に結合している水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン化低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基またはフェニル基であり、s は 1 または 2 であり、A 環はピペリジンまたはピリジンである]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する、請求項 1 記載の植物用殺線虫剤。

### Specification

#### 【発明の詳細な説明】

【0001】

#### 【発明の属する技術分野】

本発明は農薬に関し、詳細には植物用殺線虫剤に関する。

より詳細には、本発明は有機ホウ素化合物を含有する植物用殺線虫用組成物に関する。

【0002】

#### 【従来の技術】

線虫 (nematode) は分類学上、線形動物門 (Nematoda) を構成する。

線虫の種は約 100 万といわれ、その中には動植物に寄生する寄生性線虫、小生物を捕食する捕食性線虫、土壤中、水中の有機質や微生物に依存して生活する自活性線虫などがある。

農作物を加害する植物寄生性線虫は一般には、農作物の根の表面または組織内に寄生増殖し、線虫病を引き起こす。

主な線虫病にはジャガイモ、ハクサイ、イチゴなどの根腐線虫病、クワ、トマトなどの根こぶ線虫病、イネ心枯線虫病、キク葉枯線虫病などがある。

殺線虫剤はこれらの線虫類の防除のために使

nematicide . for plant which compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for R with hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , halogenated lower alkyl group , lower alkoxy group , halogenation lower alkoxy group or phenyl group which hasbeen connected to meta position or para position , as for s with 1 or 2 , as for A ring being a piperidine or a pyridine , it is ]or contains those solvent affinitive substance , states in Claim 1

#### [Description of the Invention]

[0001]

#### [Technological Field of Invention]

this invention regards pesticide , it regards nematicide for plant indetail.

In detail, as for this invention it regards composition for nematicide of the plant which contains organoboron compound .

[0002]

#### [Prior Art]

On taxonomy , Nematoda (Nematoda ) configuration it does nematode (nematode ) .

In predacious nematode , soil which parasitic nematode , small organism to which kind of nematode approximately is called 1,000,000, parasitism does to in that in plants and animals predation is done, an underwater organic and depending on the microorganism , an our actinic radiation insect etc which life is done there is.

plant parasitic nematode which agricultural crop adding is harmed generally, parasitism multiplies in surface of root of agricultural crop , or inside tissue causes nematode disease .

potato , Brassica spp. (Chinese cabbage ) , there is a strawberry or other root-lesion nematode disease , Morus bombycis Koidz. , tomato or other root knot nematode disease , rice dead heart nematode disease , Chrysanthemum morifolium Ramat. (chrysanthemum ) leaf \* nematode disease etcin main nematode disease .

nematicide is chemical which is used for preventing these

用される薬剤である。

殺線虫剤は土壌処理後、土壌中に拡散し、そこに生息する線虫に接触する必要があるため、揮発性の高いくん蒸作用をもつ薬物、例えばD-D、DCIP、クロルピクリン、臭化メチルなどが古くから使用されている。

【0003】

殺線虫剤は土壌中に生息する線虫に到達する必要があるため、自己拡散によって土壌中を移動する揮発性の高い土壌くん蒸剤が多く使用されている。

しかし、土壌燻蒸剤は栽培作物に対しても悪影響を及ぼすので、植え付けの数日～数週間前に使用し、必要に応じて残留ガスを除去しなければならない。

また、専用の処理器具を必要とし、土壌水分の多寡が拡散性を左右するため、処理時期が天候に大きく制約される。

一般に刺激臭が強いので作業者に保護具を必要とするなどいくつかの問題を抱えている。

最近登場した非燻蒸性殺線虫剤は、燻蒸剤のような自己拡散性を有しないため、あらかじめ土壌と十分に攪拌・混和しておく必要があり、簡便に使用できるとは言い難いものである。

また、混和の程度が有効性に影響し、十分な防除効果が得られない場合が多い。

このような事情を考慮し、有効性が高く、簡便に使用できる殺線虫剤の開発が要望されている。

本発明者らは鋭意検討した結果、上記従来技術の欠点を克服し、優れた殺線虫活性を有する有機ホウ素化合物を見出した。

【0004】

本件出願人は WO00/44387 にて、本発明における活性成分と同様の活性成分を含有する抗コクシジウム剤を開示している。

しかし、この抗コクシジウム剤が対象としているコクシジウム(coccidia)は原生動物(Apicomplexa 門孢子虫綱)の一亜綱であり、本発明が対象として線虫とは全く異なる。

また、コクシジウムが引き起こす感染症であるコクシジウム症は、消化管出血、死あるいは成長抑制などの種々の症状を家禽類に招来させるも

nematodes .

scattering to do nematicide after soil treatment and in soil , because it is necessary to contact nematode which inhabits there , volatility it is high , drug , for example D-D , DCIP , chloropicrin , methyl bromide etc which has steaming/evaporation action is used for a long time .

[0003]

Because as for nematicide it is necessary to arrive in nematode which inhabits in soil , soil fumigation agent where volatility which moves through soil with self scattering is high is mainly used.

But, because soil fumigation agent adverse effect is caused vis-a-vis cultivated crop , you must use before several days ~several weeks of transplantation and must remove according to need residual gas .

In addition, treatment tool of dedicated is needed, because the quantity of soil moisture influences diffusivity , treatment period is done to be large to climate constraint .

Because pungent odor is strong generally, protective gear necessity such as is done holds several problem in worker .

Recent, non- fumigation characteristic nematicide which appears because it does not possess self diffusivity like fumigant , has necessity beforehand to agitate & to mix to soil and fully , simply you can use it is something which it is difficult to say.

In addition, extent of mixture has an influence on effectiveness , when sufficient protective effect is not acquired is many.

situation a this way is considered, development of nematicide where effectiveness is high, can use simply is demanded.

these inventors result of diligent investigation, overcame deficiency of the above-mentioned Prior Art , discovered organoboron compound which possesses nematocidal activity which is superior.

[0004]

As for this Applicant with WO 00/44387, anti- [kokushijiumu ] agent which contains the active ingredient which is similar to active ingredient in this invention is disclosed.

But, [kokushijia ] (coccidia ) which this anti- [kokushijiumu ] agent has made object in linen yarn rope of protozoa (Apicomplexa gate spore insect rope ) , this invention differs from nematode completely as object .

In addition, as for coccidiosis which is an infection which [kokushijia ] causes, as for this invention we designate nematicide action for plant as objective vis-a-vis being

のであるのに対し、本発明は植物に対する殺線虫作用を目的としており、よって両者は関連する技術分野を異にしている。

有機ホウ素化合物を含有する殺線虫剤は、米国特許第 5,348,947 号、J.Chem.Soc., Perkin Trans. 1, 2000, 567-569、WO97/11952、WO97/11951、特開昭 62-277307 号および米国特許第 3,651,222 号に記載されている。

しかし、これらの化合物は本発明の殺線虫剤における有効成分の有機ホウ素化合物とは相違している。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】

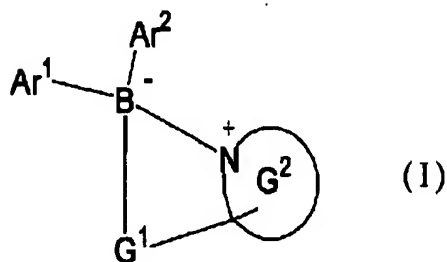
本発明の目的は有機ホウ素化合物を含有する植物用殺線虫剤を提供することにある。

【0006】

【課題を解決するための手段】

本発明は、一般式(I):

【化 8】



[式中、Ar¹ および Ar² はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基; G¹ は、式 -A-、-A-CR¹R²- または -A-CR³R⁴-CR⁵R⁶- で表される基(式中、A は酸素原子または硫黄原子、R¹-R⁶ はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい脂肪族炭化水素基、-O-(置換されていてもよい脂肪族炭化水素基)、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R¹ と R²、R³ と R⁴ および/もしくは R⁵ と R⁶ が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換さ

something which invites alimentary canal bleeding, death or growthcontrol or other various disease in domestic bird, depend and both has differed the technological field which it is related.

nematicide which contains organoboron compound, U. S. Patent No. 5, 348, 947 number, Journal of the Chemical Society (JCSIA), is stated in Perkin Trans. 1, 2000, 567-569, WO 97/11952, WO 97/11951, Japan Unexamined Patent Publication Showa 62-277307 number and U. S. Patent No. 3, 651, 222 number.

But, as for these compound it is different with organoboron compound of active ingredient in nematicide of this invention.

【0005】

[Problems to be Solved by the Invention]

objective of this invention is to offer nematicide for plant which contains organoboron compound.

【0006】

[Means to Solve the Problems]

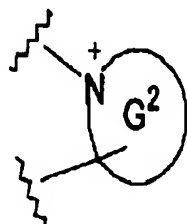
As for this invention, General Formula (I):

[Chemical Formula 8]

[In Formula, as for Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> becoming independent respectively, as for optionally substitutable cyclic group; G<sup>1</sup>, formula: -A-, -A-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- or group which is displayed with -A-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>- (In Formula, as for A as for oxygen atom or sulfur atom, R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> respective identical or different hydrogen atom, halogen atom, hydroxyl group, optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group, -O- (optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group), it is an acyloxy, optionally substitutable phenyl oxy, optionally substitutable amino group, optionally substitutable sulfo group, or an optionally substitutable aryl group, or R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> and/or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> become simultaneous and form oxo, optionally substitutable methylene or the optionally substitutable imino); formula: ]

れていてもよいイミノを形成する);式:]

【化 9】



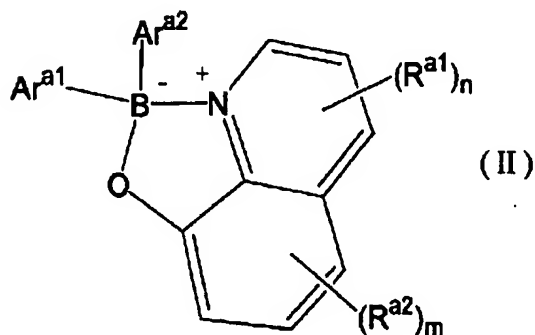
で示される基は置換されていてもよいアザ環系基;ただし、B<sup>1</sup>、G<sup>1</sup> および G<sup>2</sup> から構成される環のうち最小環は 5 員環または 6 員環であるものとする]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する植物用殺線虫剤に関する。

【0007】

好ましくは、本発明は以下の(1)-(5)に示す化合物をそれぞれ含有する植物用殺線虫剤に関する:

1) 一般式(II):

【化 10】



[式中、Ar<sup>a1</sup> は、置換されていてもよいアリール基;Ar<sup>a2</sup> は置換されていてもよい縮合アリール基;R<sup>a1</sup> および R<sup>a2</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基;n および m は同一または異

[Chemical Formula 9]

So as for group which is shown as for inside minimum ring of the ring which configuration is done 5 -member ring or 6-member ring are ] with compound or its salt which is displayed or it regards nematicide for plant which contains those solvent affinitive substance from optionally substitutable aza cyclic group ; however B<sup>1</sup> and G<sup>2</sup>.

[0007]

preferably , this invention below (1) - regards nematicide for plant which contains compound which is shown in (5) respectively:

1) General Formula (II ):

[Chemical Formula 10]

compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for Ar<sup>a1</sup>, as for optionally substitutable aryl group ;Ar<sup>a2</sup> as for optionally substitutable condensed aryl group ;R<sup>a1</sup> and R<sup>a2</sup> becoming independent respectively, as for hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or the optionally substitutable aryl group ;n and m integer of any of

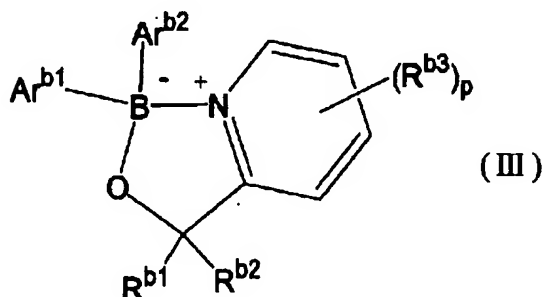


なって 0~3 のいずれかの整数を示す]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物;

[0008]

2) 一般式(III):

【化 11】



[式中、Ar<sup>b1</sup> および Ar<sup>b2</sup> は同一または異なって置換されていてもよいアリール基; R<sup>b1</sup> および R<sup>b2</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R<sup>b1</sup> と R<sup>b2</sup> が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する; R<sup>b3</sup> はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒に縮合環を形成していてもよい; p は 0~4 のいずれかの整数を示す]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物;

[0009]

identical or different 0~3 it shows ] or those solvent affinitive substance ;

[0008]

2) general formula (III ):

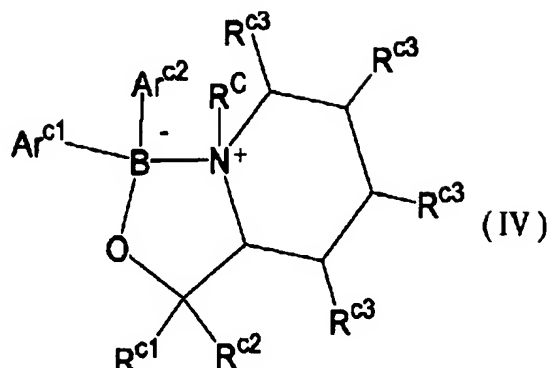
[Chemical Formula 11]

compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> as for identical or different optionally substitutable aryl group ; R<sup>b1</sup> and the R<sup>b2</sup> becoming independent respectively, it is a hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or a optionally substitutable aryl group , or or R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> become simultaneous and form oxo , optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino ; R<sup>b3</sup> becoming independent respectively, is halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or the optionally substitutable aryl group , or or is possible to form adjacent group and it becomes simultaneous and fused ring ; p shows integer of any 0 - 4 ] or those solvent affinitive substance ;

[0009]

## 3) 一般式(IV):

【化 12】



[式中、Ar<sup>c1</sup> および Ar<sup>c2</sup> はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基; R<sup>c1</sup> および R<sup>c2</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R<sup>c1</sup> と R<sup>c2</sup> が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する; R<sup>c3</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒に縮合環を形成していてもよい; R<sup>c</sup> は水素原子または低級アルキルを示す]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物;

【0010】

## 4) 一般式(V):

【化 13】

## 3) General Formula (IV):

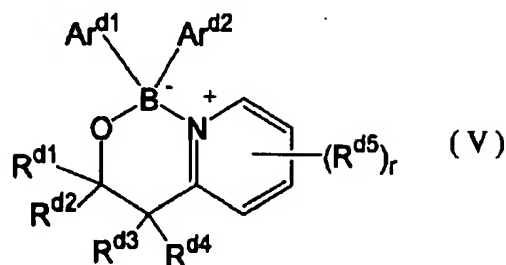
[Chemical Formula 12]

compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for Ar<sup>c1</sup> and Ar<sup>c2</sup> becoming independent respectively, as for optionally substitutable cyclic group ; R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> becoming independent respectively, it is a hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenated lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or a optionally substitutable aryl group , or or R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> become simultaneous and form oxo , optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino ; R<sup>c3</sup> becoming independent respectively, is hydrogen atom , halogen atom , lower alkyl group , lower alkenyl group , halogenated lower alkyl group , halogenation lower alkenyl group , optionally substitutable aralkyl group , hydroxyl group , lower alkoxy group , lower alkenyl oxy group , halogenation lower alkoxy group , halogenation lower alkenyl oxy group , acyloxy , optionally substitutable phenyl oxy , optionally substitutable aralkyloxy , optionally substitutable amino group , optionally substitutable sulfo group , or the optionally substitutable aryl group , or or is possible to form adjacent group and it becomes simultaneous and fused ring ; R<sup>c</sup> shows hydrogen atom or lower alkyl ] or those solvent affinitive substance ;

【0010】

## 4) General Formula (V):

[Chemical Formula 13]



[式中、Ar<sup>d1</sup> および Ar<sup>d2</sup> は同一または異なって置換されていてもよいアリール基; R<sup>d1</sup>、R<sup>d2</sup>、R<sup>d3</sup> および R<sup>d4</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R<sup>d1</sup> と R<sup>d2</sup> および/または R<sup>d3</sup> と R<sup>d4</sup> が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する; R<sup>d5</sup> はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒に縮合環を形成していてもよい; r は 0~4 のいずれかの整数を示す]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物; および

[0011]

5) 一般式(VI): 式:

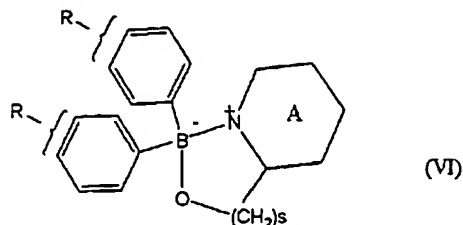
[化 14]

compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> as for identical or different optionally substitutable aryl group ; R<sup>d1</sup>, R<sup>d2</sup>, R<sup>d3</sup> and the R<sup>d4</sup> becoming independent respectively, it is a hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, halogenated lower alkyl group, halogenation lower alkenyl group, optionally substitutable aralkyl group, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, halogenation lower alkoxy group, halogenation lower alkenyl oxy group, acyloxy, optionally substitutable phenyl oxy, optionally substitutable aralkyloxy, optionally substitutable amino group, optionally substitutable sulfo group, or a optionally substitutable aryl group, or or R<sup>d1</sup> and R<sup>d2</sup> and/or R<sup>d3</sup> and R<sup>d4</sup> become simultaneous and form oxo, optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino ; R<sup>d5</sup> becoming independent respectively, is halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, halogenated lower alkyl group, halogenation lower alkenyl group, optionally substitutable aralkyl group, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, halogenation lower alkoxy group, halogenation lower alkenyl oxy group, acyloxy, optionally substitutable phenyl oxy, optionally substitutable aralkyloxy, optionally substitutable amino group, optionally substitutable sulfo group, or the optionally substitutable aryl group, or or is possible to form adjacent group and it becomes simultaneous and fused ring ; r shows integer of any 0 - 4 ] or those solvent affinitive substance ; and

[0011]

5) General Formula (VI): formula:

[Chemical Formula 14]



[式中、R はメタ位またはパラ位に結合している水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン化低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基またはフェニル基であり、s は 1 または 2 であり、A 環はピペリジンまたはピリジンである]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物。

この化合物を含有する植物用殺線虫剤のうち、より好ましい態様は、n が 2 であり、および/または R がパラ位に置換しているハロゲンである化合物を含有する植物用殺線虫剤である。

#### 【0012】

本明細書中、「植物用殺線虫剤」とは、農作物の根の表面または組織内に寄生増殖し、農作物に線虫病を引き起こす植物寄生性線虫を排除するための農薬組成物を意味する。

本発明の植物用殺線虫剤が対象とする植物寄生性線虫にはアレナリアネコブセンチュウ、イシユクセンチュウ、イチゴメセンチュウ、イネシガラセンチュウ、イネシストセンチュウ、イモグサレセンチュウ、オオガタハリセンチュウ、キクハガラセンチュウ、カタネグサレセンチュウ、クキセンチュウ、クルマミグサレセンチュウ、コムギツブセンチュウ、サツマイモネコブセンチュウ、ジャガイモシストセンチュウ、スクテロネマ、ダイズシストセンチュウ、ツブセンチュウ、テンサイシストセンチュウ、トゲワセンチュウ、ナガハリセンチュウ、ナミクキセンチュウ、ニセネコブセンチュウ、ニセネグサレセンチュウ、ネモグリセンチュウ、ピンセンチュウ、ペントグラスセンチュウ、マツノザイセンチュウ、ミカンネセンチュウ、ミナミネグサレセンチュウ、ムギシストセンチュウ、ユミハリセンチュウ、ラセンセンチュウ、およびワセンチュウなどがあるが、これらに限定されず、植物に病害を及ぼす線虫であれば本発明の対象となり得る。

compound or its salt which is displayed with [In Formula, as for R with hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, halogenated lower alkyl group, lower alkoxy group, halogenation lower alkoxy group or phenyl group which has been connected to meta position or para position, as for s with 1 or 2, as for A ring being a piperidine or a pyridine, it is ] or those solvent affinitive substance .

Among nematicide for plant which contain this compound, a more desirable embodiment, n 2, is nematicide for plant which contains compound which is a halogen which and/or R has substituted in para position .

#### 【0012】

In this specification, "nematicide for plant " with, parasitism it multiplies in surface of the root of agricultural crop, or inside tissue it means pesticide composition in order to prevent plant parasitic nematode which causes nematode disease in agricultural crop .

southern root-knot nematode, *Globodera rostochiensis* Wollenweber (potato cyst nematode), [sukuteronema], *Heterodera glycines* Ichinohe (soybean cyst nematode), seive nematode, *Beta vulgaris* L. var *saccharifera* Alef. (sugar beet) cyst nematode, *Criconea* sp. (spine nematode), *Longidorus* sp. (needle nematode), *Ditylenchus dipsaci* [kuhn] Filipjev (bulb and stem nematode), [nisenekobusenhuu], *Aphelenchus avenae* Bastian, [nemogurisenhuu], *Paratylenchus* sp. (pin nematode), *Anguina agrostis* [Steinbuck] Filipjev (bentgrass nematode), *Bursaphelenchus xylophilus* (Steiner et Buhner) Nickle (pine wood nematode), *Tylenchulidae* (citrus nematode), *Pratylenchus coffeae* [zimmermann] Filipjev et Schuurmans Stekhoven (coffee root-lesion nematode), *Bidera avenae* [Wollenweber] Krall et Krall (oat cyst nematode), *Trichodorus* sp. (stubby root nematode), *Helicotylenchus* sp. (spiral nematode), and there is a *Criconeoides* sp. (ring nematode) etc, but It is not limited in these, if it is a nematode which causes disease to plant, it can become object of this invention. In plant parasitic nematode which nematicide for plant of this invention makes the object *Meloidogyne arenaria* [Neal] Chitwood (peanut root-knot nematode), *Tylenchorhynchus* sp. (stylet nematode), *Nothotylenchus acris* Thorne (strawberry bud nematode), *Aphelenchoides besseyi* Christie (rice white-tip

本発明殺線虫剤の適用植物としては、各種栽培植物、例えばテンサイ、パイナップル、ダイズ、ラッカセイ、タマネギ、パレイショ、ダイコン、ニンジン、キュウリ、クワ、イチジク、イチゴ、リンゴ、チャ、ネギ類、タバコ、チシャ、トウガラシ、およびキク等の他、樹木(例、マツ、ヤシ)、および牧草等が挙げられる。

【0013】

本発明の殺線虫剤の有効成分である有機ホウ素化合物について以下、説明する。

上記式中、 $Ar^1$  および  $Ar^2$  で示される「置換されていてもよい環式基」とは、例えば単環式または縮合多環式の脂環式炭化水素基(例、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルカジエニル基等)、単環式または縮合多環式の芳香族炭化水素基(例、置換されていてもよいアリール基等)、単環式または縮合多環式の複素環基(例、置換されていてもよい芳香族複素環基等)、スピロ環式の炭化水素基または複素環基等をいう。

好ましくは、 $Ar^1$  および  $Ar^2$  は同一である。

【0014】

上記のシクロアルキル基の例としては、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビシクロ[2.2.1]ヘプチル、ビシクロ[2.2.2]オクチル、ビシクロ[3.2.1]オクチル、ビシクロ[3.2.2]ノニル、ビシクロ[3.3.1]ノニル、ビシクロ[4.2.1]ノニル、ビシクロ[4.3.1]デシル、アダマンチル等の炭素数3ないし20のシクロアルキル基等が挙げられる。

nematode ), *Heterodera elachista* , *Ditylenchus destructor* Thorne (potato rot nematode ) , [oogataharisenchuu ] , *Chrysanthemum morifolium* Ramat. (chrysanthemum ) *Aphelenchoides ritzemabosi* [Schwartz ] Steiner et Buhner (chrysanthemum foliar nematode ) , *Pratylenchus penetrans* [Cobb ] Filipjev et Schuurmans Stekhoven (Cobb root-lesion nematode ) , [kukisenchuu ] , *Pratylenchus vulnus* Allen et Jensen (walnut root-lesion nematode ) , *Anguina tritici* [Steinbuch ] Chitwood (Wheat nematode ) , *Meloidogyne incongnita* [Kofoid et White ] Chitwood

As application plant of this invention nematicide , various cultivated plant , for example *Beta vulgaris* L. var *saccharifera* Alef. (sugar beet ) , pineapple , soybeans , *Arachis hypogaea* L. , onion , *Solanum tuberosum* L. (potato ) , *Raphanus sativus* L. (radish ) , *Daucus carota* L. var. *sativa* DC. (carrot ) , cucumber , *Morus bombycis* Koidz. , *Ficus carica* L. , strawberry , *Malus pumila* Miller var. *domestica* Schneider (apple ) , *Thea sinensis* L. (tea ) , onion and tobacco , *Lactuca sativa* L. (lettuce ) , *Capsicum annuum* L. , and *Chrysanthemum morifolium* Ramat. (chrysanthemum ) or other other things, you can list tree (Example and pine , palm ) , and pasture etc.

【0013】

Below, you explain concerning organoboron compound which is a active ingredient of nematicide of this invention .

In above Formula , it is shown with  $Ar^{<sup>1</sup>}$  and  $Ar^{<sup>2</sup>}$  , "optionally substitutable cyclic group " with, the alicyclic hydrocarbon group of for example monocyclic or condensed polycyclic (Example and optionally substitutable cycloalkyl group , optionally substitutable cycloalkenyl group , optionally substitutable cycloalkadienyl group etc), aromatic hydrocarbon group of monocyclic or the condensed polycyclic (Example and optionally substitutable aryl group etc), heterocyclic group of monocyclic or condensed polycyclic (Example and optionally substitutable heteroaromatic group etc), it is hydrocarbon group or heterocyclic group etc of spiro cyclic .

preferably ,  $Ar^{<sup>1</sup>}$  and  $Ar^{<sup>2</sup>}$  are same.

【0014】

As example of above-mentioned cycloalkyl group , you can list for example cyclopropyl , cyclobutyl , cyclopentyl , cyclohexyl , cycloheptyl , cyclooctyl , bicyclo [2.2 . 1] heptyl , bicyclo [2.2 . 2] octyl , bicyclo [3.2 . 1] octyl , bicyclo [3.2 . 2] nonyl , bicyclo [3.3 . 1] nonyl , bicyclo [4.2 . 1] nonyl , bicyclo [4.3 . 1] decyl , adamantyl or other carbon number 3 to 20 cycloalkyl group etc.

上記のシクロアルケニル基の例としては、例えば 2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル等の炭素数 4 ないし 20 のシクロアルケニル基等が挙げられる。

【0015】

上記のシクロアルカジエニル基の例としては、例えば 2,4-シクロペンタジエン-1-イル、2,4-シクロヘキサジエン-1-イル、2,5-シクロヘキサジエン-1-イル等の炭素数 4 ないし 20 のシクロアルカジエニル基等が挙げられる。

【0016】

上記の「アリール基」としては、例えばフェニル、インデニル、ナフチル(1-ナフチル、2-ナフチル等)、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル、フルオレニル(9-フルオレニル、1-フルオレニル等)等の炭素数 6 ないし 20 のアリール基等が挙げられる。

【0017】

上記の「複素環基」としては、環系を構成する原子として酸素、硫黄、窒素の少なくとも 1 個のヘテロ原子を含有する複素環基を意味し、単環式複素環基または縮合多環式複素環基が挙げられる。

単環式複素環基の具体例としては、例えばイソオキサゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、オキサゾリル、フラザニル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、チアゾリル、チエニル、テトラゾリル、トリアジニル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、ピラニル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピロリル、2H-ピロリル、フラザニル、フリル等が挙げられる。

【0018】

縮合多環式複素環基の具体例としては、

例えばアクリジニル、

5-アザベンゾ[a]アントラセニル、

イソインドリル、イソキノリル、イソクロマニル、イソベンゾフラニル、イミダゾ[2,1-b]チアゾリル、4H-イミダゾ[4,5-d]チアゾリル、イミダゾ[1,2-b][1,2,4]トリアジニル、イミダゾ[1,2-a]ピリジル、イミダゾ[1,5-a]ピリジル、イミダゾ[1,2-b]ピリダジニル、イミダゾ[1,2-a]ピリミジニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、1H-インダゾリル、インドリジニル、インドリル、4H[1,3]-オキサチオロ[5,4-b]ピロリル、1H-2-オキサピレニル、カルバ

As example of above-mentioned cycloalkenyl group , for example 2- cyclobutene -1- yl , 3- cyclobutene -1- yl , 2- cyclohexene -1- yl , 3- cyclohexene -1- yl or other carbon number 4 or you can list the cycloalkenyl group etc of 20.

【0015】

As example of above-mentioned cycloalkadienyl group , for example 2, 4- cyclopentadiene -1- yl , 2, 4- cyclohexadiene -1- yl , 2, 5-cyclohexadiene -1- yl or other carbon number 4 or you can list the cycloalkadienyl group etc of 20.

【0016】

Description above "aryl group " as, for example phenyl , indenyl , naphthyl (1 -naphthyl , 2- naphthyl etc), you can list anthryl , phenanthryl , acenaphthylenyl , fluorenyl (9 -fluorenyl , 1- fluorenyl etc) or other carbon number 6 to 20 aryl group etc.

【0017】

Description above "heterocyclic group " as, it means heterocyclic group which contains heteroatom of at least one of oxygen , sulfur , nitrogen configuration is done ring system as atom which can list monocyclic heterocyclic group or condensed polycyclic heterocyclic group .

As embodiment of monocyclic heterocyclic group , you can list for example isooxazolyl , isothiazolyl , imidazolyl , 1, 2, 3- oxadiazolyl , 1, 3, 4- oxadiazolyl , oxazolyl , furazanyl , 1, 2, 3- thiadiazolyl , 1, 2, 4- thiadiazolyl , 1, 3, 4- thiadiazolyl , thiazolyl , thienyl , tetrazolyl , triazinyl , 1, 2, 3- triazolyl , 1, 2, 4- triazolyl , pyranlyl , pyrazinyl , pyrazolyl , pyridyl , pyridazinyl , pyrimidinyl , pyrrolyl , 2H-pyrrolyl , furazanyl , furyl etc.

【0018】

As embodiment of condensed polycyclic heterocyclic group , for example acridinyl ,

5 -aza benzo [a ] anthracenyl ,

iso indolyl , isoquinolyl , iso chromanyl , isobenzofuranyl , imidazo {2 and 1 -b } thiazolyl , 4H-imidazo {4 and 5 -d } thiazolyl , imidazo {1 and 2 -b } {1, 2 and 4} triazinyl , imidazo {1 and 2 -a } pyridyl , imidazo {1 and 5 -a } pyridyl , imidazo {1 and 2 -b } pyridazinyl , imidazo {1 and 2 -a } pyrimidinyl , imidazolidinyl , imidazolinylyl , 1H-indazolyl , indolidinyl , indolyl , 4H {1 and 3 } -oxa thiole {5 and 4 -b } pyrrolyl , 1H-2- oxa pyrenyl , carbozolyl , ;al -carbolinyl , ;be -carbolinyl , ;ga -carbolinyl , quinazolinyl , quinoxalinyl ,

ゾリル、 $\alpha$ -カルボリニル、 $\beta$ -カルボリニル、 $\gamma$ -カルボリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、キノリル、クロマニル、4H-1,3-ジオキサソロ[4,5-b]イミダゾリル、シクロペンタ[b]ピラニル、2,3-ジチア-1,5-ジアザインダニル、4H-1,3-ジチアナフタレニル、1,4-ジチアナフタレニル、シンノニル、チアントレニル、チエノ[2,3-b]フラニル、2,7,9-トリアザフェナントレニル、1,2,4-トリアゾロ[4,3-a]ピリダジニル、1,2,4-トリアゾロ[4,3-a]ピリジル、2,4,6-トリチア-3a,7a-ジアザインダニル-ナフチリジニル、ピベラジニル、ピベリジル、ピラゾリジニル、7H-ピラジノ[2,3-c]カルバゾリル、ピラジノ[2,3-d]ピリダジニル、1H-ピラゾロ[4,3-d]オキサゾリル、ピラゾロ[1,5-a]ピリジル、ピリド[1',2':1,2]イミダゾ[4,5-b]キノキサリニル、5H-ピリド[2,3-d]-o-オキサジニル、4H-ピリド[2,3-c]カルバゾリル、ピロリジニル、ピロリニル、1H-ピロロ[1,2-b][2]ベンゾアゼピニル、ピロロ[1,2-b]ピリダジニル、フェナジニル、フェナトリジニル、フェナトリニル、フェノキサジニル、フェノキサチニル、フェノチアジニル、フタラジニル、プテリジニル、プリニル、2H-フロ[3,2-b]ピラニル、フロ[3,4-c]シンシノリニル、1,2-ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾ[h]イソクノリル、1,2-ベンゾイソチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、4H-3,1-ベンゾオキサジニル、3-ベンゾオキセピニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾ[b]チエニル、1H-ベンゾトリアゾリル、ベンゾ[b]フラニル、モルホリニル、等が挙げられる。

#### 【0019】

Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> で示される「置換されていてもよい環式基」として好ましい基は置換されていてもよいアリール基であり、詳細には例えば、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルコキシ基、アリール基、ヒドロキシ基、アシル基、アミノ基等によって置換されていてもよいアリール基が挙げられる。

なお、Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> におけるアリール基または複素環基の置換基の数は1つに限定されず、またその種類も1つに限定されない。

#### 【0020】

以下、置換されていてもよいアリール基のうち置換基の種類がひとつである場合について主な具体例を列挙する。

「ハロゲン原子」とは、例えばフッ素、塩素、臭素等を表す。

quinolyl, chromanyl, 4H-1, 3- [jiokisoro] {4 and 5 -b} imidazolyl, cyclopenta [b] pyranlyl, 2, 3- di thia -1, 5-diaza indanyl, 4H-1, 3- di thia naphthalenyl, 1, 4- di thia naphthalenyl, syn nonyl, thianthrenyl, thieno {2 and 3 -b} furanyl, 2, 7, 9-triaza phenanthrenyl, 1, 2, 4- triazolo {4 and 3 -a} pyridazinyl, 1, 2, 4- triazolo {4 and 3 -a} pyridyl, 2, 4, 6-tri thia -3a, 7a-diaza indanyl -naphthyridinyl, piperazinyl, bipyridyl, pyrazolidinyl, 7H-pyrazino {2 and 3 -c} carbozoyl, pyrazino {2 and 3 -d} pyridazinyl, 1H-pyrazolo {4 and 3 -d} oxazolyl, pyrazolo {1 and 5 -a} pyridyl, pyrido {1' and 2': 1 and 2} imidazo {4 and 5 -b} quinoxaliny, 5H-pyrido {2 and 3 -d} -o-oxazinyl, 4H-pyrido {2 and 3 -c} carbozoyl, pyrrolidinyl, pyrrolinyl, 1H-pyrrolo {1 and 2 -b} [2] benzo azepinyl, pyrrolo {1 and 2 -b} pyridazinyl, phenazinyl, phenathridinyl, [fenatororinir], phenoxazinyl, phenoxathiinyl, phenothiazinyl, phthalazinyl, pteridinyl, purinyl, 2H-furo {3 and 2 -b} pyranlyl, furo {3 and 4 -c} [shinshinorinir], 1, 2 -benzo isooxazolyl, benzo {h} [isokunorir], 1 and 2 -benzo isothiazolyl, benzoimidazolyl, benzo oxazolyl, 4H-3, 1- benzo oxazinyl, 3- [benzookisepinir], you can list benzo thiazolyl, benzo [b] thienyl, 1H-benzotriazolyl, benzo [b] furanyl, morpholinyl, etc.

#### 【0019】

It is shown with Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup>, as for desirable basis with optionally substitutable aryl group, you can list in detail optionally substitutable aryl group with such as for example halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, lower alkoxy group, halogenated lower alkyl group, halogenation lower alkenyl group, halogenation lower alkoxy group, aryl group, hydroxyl group, acyl group, amino group "optionally substitutable cyclic group" as.

Furthermore, number of substituents of aryl group or heterocyclic group in Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> is not limited in one, in addition either types is not limited in one.

#### 【0020】

When below, types of inside substituent of optionally substitutable aryl group is one, being attached, it enumerates main embodiment.

"halogen atom" With, for example fluorine, chlorine, bromine etc is displayed.

よって、

上記のハロゲン原子で置換されたアリール基としては、

例えば2-ハロゲン化フェニル(例、2-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、2-ブロモフェニル等)、

3-ハロゲン化フェニル(例、3-フルオロフェニル、3-クロロフェニル、3-ブロモフェニル等)、

4-ハロゲン化フェニル(例、4-フルオロフェニル、4-クロロフェニル、4-ブロモフェニル等)、

2-ハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、2-フルオロナフタレン-1-イル、2-クロロナフタレン-1-イル、2-ブロモナフタレン-1-イル等)、

3-ハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、3-フルオロナフタレン-1-イル、3-クロロナフタレン-1-イル、3-ブロモナフタレン-1-イル等)、

4-ハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、4-フルオロナフタレン-1-イル、4-クロロナフタレン-1-イル、4-ブロモナフタレン-1-イル等)、

5-ハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、5-フルオロナフタレン-1-イル、5-クロロナフタレン-1-イル、5-ブロモナフタレン-1-イル等)、

6-ハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、6-フルオロナフタレン-1-イル、6-クロロナフタレン-1-イル、6-ブロモナフタレン-1-イル等)、

7-ハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、7-フルオロナフタレン-1-イル、7-クロロナフタレン-1-イル、7-ブロモナフタレン-1-イル等)、

8-ハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、8-フルオロナフタレン-1-イル、8-クロロナフタレン-1-イル、8-ブロモナフタレン-1-イル等)、

1-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、1-フルオロナフタレン-2-イル、1-クロロナフタレン-2-イル、1-ブロモナフタレン-2-イル等)、

3-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、3-フルオロナフタレン-2-イル、3-クロロナフタレン-2-イル、3-ブロモナフタレン-2-イル等)、

4-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、4-フルオロナフタレン-2-イル、4-クロロナフタレン-2-イル、4-ブロモナフタレン-2-イル等)、

5-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、5-フルオロナフタレン-2-イル、5-クロロナフタレン-2-イル、5-ブロモナフタレン-2-イル等)、

6-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、6-フルオロナフタレン-2-イル、6-クロロナフタレン-2-イル、6-

Depending,

As aryl group which is substituted with above-mentioned halogen atom,

for example 2- halogenation phenyl (Example, 2 -fluorophenyl, 2- chlorophenyl, 2- bromophenyl etc),

3 -halogenation phenyl (Example, 3 -fluorophenyl, 3- chlorophenyl, 3- bromophenyl etc),

4 -halogenation phenyl (Example, 4 -fluorophenyl, 4- chlorophenyl, 4- bromophenyl etc),

2 -halogenation naphthalene -1- yl (Example, 2 -fluoro naphthalene -1- yl, 2- chloro naphthalene -1- yl, 2- bromonaphthalene -1- yl etc),

3 -halogenation naphthalene -1- yl (Example, 3 -fluoro naphthalene -1- yl, 3- chloro naphthalene -1- yl, 3- bromonaphthalene -1- yl etc),

4 -halogenation naphthalene -1- yl (Example, 4 -fluoro naphthalene -1- yl, 4- chloro naphthalene -1- yl, 4- bromonaphthalene -1- yl etc),

5 -halogenation naphthalene -1- yl (Example, 5 -fluoro naphthalene -1- yl, 5-chloro naphthalene -1- yl, 5-bromonaphthalene -1- yl etc),

6 -halogenation naphthalene -1- yl (Example, 6 -fluoro naphthalene -1- yl, 6-chloro naphthalene -1- yl, 6-bromonaphthalene -1- yl etc),

7 -halogenation naphthalene -1- yl (Example, 7 -fluoro naphthalene -1- yl, 7-chloro naphthalene -1- yl, 7-bromonaphthalene -1- yl etc),

8 -halogenation naphthalene -1- yl (Example, 8 -fluoro naphthalene -1- yl, 8-chloro naphthalene -1- yl, 8-bromonaphthalene -1- yl etc),

1 -halogenation naphthalene -2- yl (Example, 1 -fluoro naphthalene -2- yl, 1- chloro naphthalene -2- yl, 1- bromonaphthalene -2- yl etc),

3 -halogenation naphthalene -2- yl (Example, 3 -fluoro naphthalene -2- yl, 3- chloro naphthalene -2- yl, 3- bromonaphthalene -2- yl etc),

4 -halogenation naphthalene -2- yl (Example, 4 -fluoro naphthalene -2- yl, 4- chloro naphthalene -2- yl, 4- bromonaphthalene -2- yl etc),

5 -halogenation naphthalene -2- yl (Example, 5 -fluoro naphthalene -2- yl, 5-chloro naphthalene -2- yl, 5-bromonaphthalene -2- yl etc),

6 -halogenation naphthalene -2- yl (Example, 6 -fluoro naphthalene -2- yl, 6-chloro naphthalene -2- yl,



ブromonaphthalene-2-yl等)、

7-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、7-フルオロナフタレン-2-イル、7-クロロナフタレン-2-イル、7-ブromonaphthalene-2-yl等)、

8-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、8-フルオロナフタレン-2-イル、8-クロロナフタレン-2-イル、8-ブromonaphthalene-2-yl等)、

2-ハロゲン化インデン-1-イル(例、2-フルオロインデン-1-イル、2-クロロインデン-1-イル、2-ブromoindene-1-yl等)、

3-ハロゲン化インデン-1-イル(例、3-フルオロインデン-1-イル、3-クロロインデン-1-イル、3-ブromoindene-1-yl等)、

4-ハロゲン化インデン-1-イル(例、4-フルオロインデン-1-イル、4-クロロインデン-1-イル、4-ブromoindene-1-yl等)、

5-ハロゲン化インデン-1-イル(例、5-フルオロインデン-1-イル、5-クロロインデン-1-イル、5-ブromoindene-1-yl等)、

6-ハロゲン化インデン-1-イル(例、6-フルオロインデン-1-イル、6-クロロインデン 1-イル、6-ブromoindene-1-yl等)、

7-ハロゲン化インデン-1-イル(例、7-フルオロインデン-1-イル、7-クロロインデン-1-イル、7-ブromoindene-1-yl等)、

1-ハロゲン化インデン-2-イル(例、1-フルオロインデン-2-イル、1-クロロインデン-2-イル、1-ブromoindene-2-yl等)、

3-ハロゲン化インデン-2-イル(例、3-フルオロインデン-2-イル、3-クロロインデン-2-イル、3-ブromoindene-2-yl等)、

4-ハロゲン化インデン-2-イル(例、4-フルオロインデン-2-イル、4-クロロインデン-2-イル、4-ブromoindene-2-yl等)、

5-ハロゲン化インデン-2-イル(例、5-フルオロインデン-2-イル、5-クロロインデン-2-イル、5-ブromoindene-2-yl等)、

6-ハロゲン化インデン-2-イル(例、6-フルオロインデン-2-イル、6-クロロインデン-2-イル、6-ブromoindene-2-yl等)、

7-ハロゲン化インデン-2-イル(例、7-フルオロインデン-2-イル、7-クロロインデン-2-イル、7-ブromoindene-2-yl等)、7-ハロゲン化インデン-4-イル(例、7-フルオロインデン-4-イル、7-クロロインデン-4-イル、7-ブromoindene-4-yl等)、5-ハロゲン化インデン-3-イル(例、5-フルオロイン

6-bromonaphthalene -2- yl etc),

7 -halogenation naphthalene -2- yl (Example, 7 -fluoro naphthalene -2- yl , 7-chloro naphthalene -2- yl , 7-bromonaphthalene -2- yl etc),

8 -halogenation naphthalene -2- yl (Example, 8 -fluoro naphthalene -2- yl , 8-chloro naphthalene -2- yl , 8-bromonaphthalene -2- yl etc),

2 -halogenation indene -1- yl (Example, 2 -fluoro indene -1- yl , 2- chloro indene -1- yl , 2- bromo indene -1- yl etc),

3 -halogenation indene -1- yl (Example, 3 -fluoro indene -1- yl , 3- chloro indene -1- yl , 3- bromo indene -1- yl etc),

4 -halogenation indene -1- yl (Example, 4 -fluoro indene -1- yl , 4- chloro indene -1- yl , 4- bromo indene -1- yl etc),

5 -halogenation indene -1- yl (Example, 5 -fluoro indene -1- yl , 5-chloro indene -1- yl , 5-bromo indene -1- yl etc),

6 -halogenation indene -1- yl (Example, 6 -fluoro indene -1- yl , 6-chloro indene 1- yl , 6-bromo indene -1- yl etc),

7 -halogenation indene -1- yl (Example, 7 -fluoro indene -1- yl , 7-chloro indene -1- yl , 7-bromo indene -1- yl etc),

1 -halogenation indene -2- yl (Example, 1 -fluoro indene -2- yl , 1- chloro indene -2- yl , 1- bromo indene -2- yl etc),

3 -halogenation indene -2- yl (Example, 3 -fluoro indene -2- yl , 3- chloro indene -2- yl , 3- bromo indene -2- yl etc),

4 -halogenation indene -2- yl (Example, 4 -fluoro indene -2- yl , 4- chloro indene -2- yl , 4- bromo indene -2- yl etc),

5 -halogenation indene -2- yl (Example, 5 -fluoro indene -2- yl , 5-chloro indene -2- yl , 5-bromo indene -2- yl etc),

6 -halogenation indene -2- yl (Example, 6 -fluoro indene -2- yl , 6-chloro indene -2- yl , 6-bromo indene -2- yl etc),

7 -halogenation indene -2- yl (Example, 7 -fluoro indene -2- yl , 7-chloro indene -2- yl , 7-bromo indene -2- yl etc), 7 -halogenation indene -4- yl (Example, 7 -fluoro indene -4- yl , 7-chloro indene -4- yl , 7-bromo indene -4- yl etc), 5 -halogenation indene -3- yl (Example, 5 -fluoro indene -3- yl , 5-chloro indene -3- yl , 5-bromo indene -3- yl etc), 3

デン-3-イル、5-クロロインデン-3-イル、5-ブロモインデン-3-イル等)、3-ハロゲン化インデン-5-イル(例、3-フルオロインデン-5-イル、3-クロロインデン-5-イル、3-ブロモインデン-5-イル等)、2-ハロゲン化インデン-6-イル(例、2-フルオロインデン-6-イル、2-クロロインデン-6-イル、2-ブロモインデン-6-イル等)、4-ハロゲン化インデン-7-イル(例、4-フルオロインデン-7-イル、4-クロロインデン-7-イル、4-ブロモインデン-7-イル等)、1-ハロゲン化インデン-4-イル(例、1-フルオロインデン-4-イル、1-クロロインデン-4-イル、1-ブロモインデン-4-イル等)、2,3-ジハロゲン化フェニル(例、2,3-ジフルオロフェニル、2,3-ジクロロフェニル、2,3-ジブロモフェニル等)、2,3-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、2,3-ジフルオロナフタレン-1-イル、2,3-ジクロロナフタレン-1-イル、2,3-ジブロモナフタレン-1-イル等)、2,4-ジハロゲン化フェニル(例、2,4-ジフルオロフェニル、2,4-ジクロロフェニル、2,4-ジブロモフェニル等)、2,6-ジハロゲン化フェニル(例、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、2,6-ジブロモフェニル等)、4,5-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、4,5-ジフルオロナフタレン-1-イル、4,5-ジクロロナフタレン-1-イル、4,5-ジブロモナフタレン-1-イル等)、4,6-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、4,6-ジフルオロナフタレン-1-イル、4,6-ジクロロナフタレン-1-イル、4,6-ジブロモナフタレン-1-イル等)、4,8-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル(例、4,8-ジフルオロナフタレン-1-イル、4,8-ジクロロナフタレン-1-イル、4,8-ジブロモナフタレン-1-イル等)等が挙げられる。

このように、それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。

#### 【0021】

上記の「低級アルキル」としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル等の直鎖状または分枝状の炭素数 1 ないし 10 のアルキル基等が挙げられる。

なお、本明細書中、「低級」なる用語は、別に定めのない限り、アルキル基、アルケニル基等の脂肪族炭化水素基中の炭素原子数が 1~10、好ましくは 1~8、さらに好ましくは 1~6 を示すものとする。

よって、上記の低級アルキルで置換されたアリール基としては、例えば 2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル

-halogenation indene -5-yl (Example, 3-fluoro indene -5-yl, 3-chloro indene -5-yl, 3-bromo indene -5-yl etc), 2-halogenation indene -6-yl (Example, 2-fluoro indene -6-yl, 2-chloro indene -6-yl, 2-bromo indene -6-yl etc), 4-halogenation indene -7-yl (Example, 4-fluoro indene -7-yl, 4-chloro indene -7-yl, 4-bromo indene -7-yl etc), 1-halogenation indene -4-yl (Example, 1-fluoro indene -4-yl, 1-chloro indene -4-yl, 1-bromo indene -4-yl etc), 2 and 3-dihalogenation phenyl (Example, 2 and 3-difluoro phenyl, 2, 3-dichlorophenyl, 2, 3-dibromophenyl etc), 2 and 3-dihalogenation naphthalene -1-yl (Example, 2 and 3-difluoro naphthalene -1-yl, 2, 3-dichloro naphthalene -1-yl, 2, 3-dibromo naphthalene -1-yl etc), 2 and 4-dihalogenation phenyl (Example, 2 and 4-difluoro phenyl, 2, 4-dichlorophenyl, 2, 4-dibromophenyl etc), 2 and 6-dihalogenation phenyl (Example, 2 and 6-difluoro phenyl, 2, 6-dichlorophenyl, 2, 6-dibromophenyl etc), 4 and 5-dihalogenation naphthalene -1-yl (Example, 4 and 5-difluoro naphthalene -1-yl, 4, 5-dichloro naphthalene -1-yl, 4, 5-dibromo naphthalene -1-yl etc), 4 and 6-dihalogenation naphthalene -1-yl (Example, 4 and 6-difluoro naphthalene -1-yl, 4, 6-dichloro naphthalene -1-yl, 4, 6-dibromo naphthalene -1-yl etc), 4 and 8-dihalogenation naphthalene -1-yl you can list (Example, 4 and 8-difluoro naphthalene -1-yl, 4, 8-dichloro naphthalene -1-yl, 4, 8-dibromo naphthalene -1-yl etc) etc.

this way, if it is a phenyl group as respective substituted position, if 2-, 3-, 4-, is naphthalene -1-yl, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- it is and especially is not limited.

#### 【0021】

Description above "lower alkyl" as, you can list carbon number 1 of for example methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, pentyl, isopentyl, neopentyl, t-pentyl, 1-ethyl propyl, hexyl or other straight chain or branched or the alkyl group etc of 10.

Furthermore, if in this specification, as for term which becomes "lower", there is not rule separately, number of carbon atoms in alkyl group, alkenyl group or other aliphatic hydrocarbon group 1 - 10, preferably 1~8, furthermore show preferably 1~6.

Depending, you can list for example 2-methylphenyl, 3-methylphenyl, 4-methylphenyl, 2-ethylphenyl, 3-ethylphenyl, 4-ethylphenyl, 2-methyl naphthalene -1-yl, 3-

ル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、2-メチルナフタレン-1-イル、3-メチルナフタレン-1-イル、4-メチルナフタレン-1-イル、5-メチルナフタレン-1-イル、6-メチルナフタレン-1-イル、7-メチルナフタレン-1-イル、8-メチルナフタレン-1-イル、2,4-ジメチルフェニル、2,4,6-トリメチルフェニル、4,5-ジメチルナフタレン-1-イル、4,6-ジメチルナフタレン-1-イル、4,8-ジメチルナフタレン-1-イル、2-メチルインデン-1-イル、3-メチルインデン-1-イル、4-メチルインデン-1-イル、5-メチルインデン-1-イル、6-メチルインデン-1-イル、7-メチルインデン-1-イル、1-メチルインデン-2-イル、3-メチルインデン-2-イル、4-メチルインデン-2-イル、5-メチルインデン-2-イル、6-メチルインデン-2-イル、7-メチルインデン-2-イル、1-メチルインデン-3-イル、2-メチルインデン-3-イル、4-メチルインデン-3-イル、5-メチルインデン-3-イル、6-メチルインデン-3-イル、7-メチルインデン-3-イル、1-メチルインデン-4-イル、2-メチルインデン-4-イル、3-メチルインデン-4-イル、5-メチルインデン-4-イル、6-メチルインデン-4-イル、7-メチルインデン-4-イル、1-メチルインデン-5-イル、2-メチルインデン-5-イル、3-メチルインデン-5-イル、4-メチルインデン-5-イル、6-メチルインデン-5-イル、7-メチルインデン-5-イル、1-メチルインデン-6-イル、2-メチルインデン-6-イル、3-メチルインデン-6-イル、4-メチルインデン-6-イル、5-メチルインデン-6-イル、7-メチルインデン-6-イル、1-メチルインデン-7-イル、2-メチルインデン-7-イル、3-メチルインデン-7-イル、4-メチルインデン-7-イル、5-メチルインデン-7-イル、6-メチルインデン-7-イル等が挙げられる。

それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。

【0022】

上記の「低級アルケニル基」としては、例えばビニル、アリル、イソプロペニル、1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル等の直鎖状または分枝状の炭素数 2 ないし 10 のアルケニル基が挙げられる。

よって、上記の低級アルケニルで置換されたアリール基としては、例えば、2-ビニルフェニル、3-ビニルフェニル、4-ビニルフェニル、2-アリルフェニル、3-アリルフェニル、4-アリルフェニル、2-ビニルナフタレン-1-イル、3-ビニルナフタレン-1-イル、4-ビニルナフタレン-1-イル、5-ビニルナフタ

methyl naphthalene -1- yl , 4- methyl naphthalene -1- yl , 5-methyl naphthalene -1- yl , 6-methyl naphthalene -1- yl , 7-methyl naphthalene -1- yl , 8-methyl naphthalene -1- yl , 2, 4- dimethylphenyl , 2, 4, 6-trimethyl phenyl , 4, 5-dimethyl naphthalene -1- yl , 4, 6-dimethyl naphthalene -1- yl , 4, 8-dimethyl naphthalene -1- yl , 2- methyl indene -1- yl , 3- methyl indene -1- yl , 4- methyl indene -1- yl , 5-methyl indene -1- yl , 6-methyl indene -1- yl , 7-methyl indene -1- yl , 1- methyl indene -2- yl , 3- methyl indene -2- yl , 4- methyl indene -2- yl , 5-methyl indene -2- yl , 6-methyl indene -2- yl , 7-methyl indene -2- yl , 1- methyl indene -3- yl , 2- methyl indene -3- yl , 4- methyl indene -3- yl , 5-methyl indene -3- yl , 6-methyl indene -3- yl , 7-methyl indene -3- yl , 1- methyl indene -4- yl , 2- methyl indene -4- yl , 3- methyl indene -4- yl , 5-methyl indene -4- yl , 6-methyl indene -4- yl , 7-methyl indene -4- yl , 1- methyl indene -5-yl , 2- methyl indene -5-yl , 3- methyl indene -5-yl , 4- methyl indene -5-yl , 6-methyl indene -5-yl , 7-methyl indene -5-yl , 1- methyl indene -6-yl , 2- methyl indene -6-yl , 3- methyl indene -6-yl , 4- methyl indene -6-yl , 5-methyl indene -6-yl , 7-methyl indene -6-yl , 1- methyl indene -7-yl , 2- methyl indene -7-yl , 3- methyl indene -7-yl , 4- methyl indene -7-yl , 5-methyl indene -7-yl , 6-methyl indene -7-yl etc as aryl group which is substituted with above-mentioned lower alkyl .

As respective substituted position , if it is a phenyl group , if 2 -, 3 -, 4 -, is the naphthalene -1- yl , 2 -, 3 -, 4 -, 5 -, 6 -, 7 -, 8 - it is and especially is not limited.

【0022】

Description above "lower alkenyl group " as, you can list carbon number 2 of for example vinyl , allyl , isopropenyl , 1-propenyl , 2- methyl -1- propenyl , 1- butenyl , 2- butenyl , 3- butenyl , 2- ethyl -1- butenyl , 3- methyl -2- butenyl , 1- pentenyl , 2- pentenyl , 3- pentenyl , 4- pentenyl , 4- methyl -3- pentenyl or other straight chain or branched or the alkenyl group of 10.

Depending, you can list for example 2- vinyl phenyl , 3- vinyl phenyl , 4- vinyl phenyl , 2- allyl phenyl , 3- allyl phenyl , 4- allyl phenyl , 2- vinyl naphthalene -1- yl , 3- vinyl naphthalene -1- yl , 4- vinyl naphthalene -1- yl , 5-vinyl naphthalene -1- yl , 6-vinyl naphthalene -1- yl , 7-vinyl naphthalene -1- yl , 8-vinyl naphthalene -1- yl , 2- vinyl

レン-1-イル、6-ビニルナフタレン-1-イル、7-ビニルナフタレン-1-イル、8-ビニルナフタレン-1-イル、2-ビニルインデン-1-イル、3-ビニルインデン-1-イル、4-ビニルインデン-1-イル、5-ビニルインデン-1-イル、6-ビニルインデン-1-イル、7-ビニルインデン-1-イル、1-ビニルインデン-2-イル、3-ビニルインデン-2-イル、4-ビニルインデン-2-イル、5-ビニルインデン-2-イル、6-ビニルインデン-2-イル、7-ビニルインデン-2-イル、1-ビニルインデン-3-イル、2-ビニルインデン-3-イル、4-ビニルインデン-3-イル、5-ビニルインデン-3-イル、6-ビニルインデン-3-イル、7-ビニルインデン-3-イル、1-ビニルインデン-4-イル、2-ビニルインデン-4-イル、3-ビニルインデン-4-イル、5-ビニルインデン-4-イル、6-ビニルインデン-4-イル、7-ビニルインデン-4-イル、1-ビニルインデン-5-イル、2-ビニルインデン-5-イル、3-ビニルインデン-5-イル、4-ビニルインデン-5-イル、6-ビニルインデン-5-イル、7-ビニルインデン-5-イル、1-ビニルインデン-6-イル、2-ビニルインデン-6-イル、3-ビニルインデン-6-イル、4-ビニルインデン-6-イル、5-ビニルインデン-6-イル、7-ビニルインデン-6-イル、1-ビニルインデン-7-イル、2-ビニルインデン-7-イル、3-ビニルインデン-7-イル、4-ビニルインデン-7-イル、5-ビニルインデン-7-イル、6-ビニルインデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

【0023】

上記の「低級アルコキシ基」としては、例えばメキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、ペントキシ、イソペントキシ等の炭素数 1 ないし 10 のアルコキシ基が挙げられる。

よって、上記の低級アルコキシ基で置換されたアリール基としては、例えば 2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、2-メトキシナフタレン-1-イル、3-メトキシナフタレン-1-イル、4-メトキシナフタレン-1-イル、5-メトキシナフタレン-1-イル、6-メトキシナフタレン-1-イル、7-メトキシナフタレン-1-イル、8-メトキシナフタレン-1-イル、2,4-ジメトキシフェニル、2,4,6-トリメトキシフェニル、4,5-ジメトキシナフタレン-1-イル、4,6-ジメトキシナフタレン-1-イル、4,8-ジメトキシナフタレン-1-イル、1-メトキシインデン-2-イル、1-メトキシインデン-3-イル、1-メトキシインデン-4-イル、1-メトキシインデン-5-イル、1-メトキシインデン-6-イル、1-メトキシインデン-7-イル、1,3-ジメトキシインデン-2-イル、1,2-ジメトキシインデン-3-イル、1,3-ジメトキシインデン-4-イル、2,3-ジメトキシインデン-5-イル、1,4-ジメトキシインデン-6-イル、1,4-ジメトキシインデン-7-

indene -1- yl , 3- vinyl indene -1- yl , 4- vinyl indene -1- yl , 5- vinyl indene -1- yl , 6- vinyl indene -1- yl , 7- vinyl indene -1- yl , 1- vinyl indene -2- yl , 3- vinyl indene -2- yl , 4- vinyl indene -2- yl , 5- vinyl indene -2- yl , 6- vinyl indene -2- yl , 7- vinyl indene -2- yl , 1- vinyl indene -3- yl , 2- vinyl indene -3- yl , 4- vinyl indene -3- yl , 5- vinyl indene -3- yl , 6- vinyl indene -3- yl , 7- vinyl indene -3- yl , 1- vinyl indene -4- yl , 2- vinyl indene -4- yl , 3- vinyl indene -4- yl , 5- vinyl indene -4- yl , 6- vinyl indene -4- yl , 7- vinyl indene -4- yl , 1- vinyl indene -5- yl , 2- vinyl indene -5- yl , 3- vinyl indene -5- yl , 4- vinyl indene -5- yl , 6- vinyl indene -5- yl , 7- vinyl indene -5- yl , 1- vinyl indene -6- yl , 2- vinyl indene -6- yl , 3- vinyl indene -6- yl , 4- vinyl indene -6- yl , 5- vinyl indene -6- yl , 7- vinyl indene -6- yl , 1- vinyl indene -7- yl , 2- vinyl indene -7- yl , 3- vinyl indene -7- yl , 4- vinyl indene -7- yl , 5- vinyl indene -7- yl , 6- vinyl indene -7- yl etc, as aryl group which is substituted with above-mentioned lower alkenyl , but it is not limited in these.

【0023】

Description above "lower alkoxy group " as, for example methoxy , ethoxy , propoxy , isopropoxy , butoxy , isobutoxy , s- butoxy , t- butoxy , pentoxy , iso pentoxy or other carbon number 1 or you can list alkoxy group of 10.

Depending, you can list for example 2- methoxyphenyl , 3- methoxyphenyl , 4- methoxyphenyl , 2- ethoxy phenyl , 3- ethoxy phenyl , 4- ethoxy phenyl , 2- methoxy naphthalene -1- yl , 3- methoxy naphthalene -1- yl , 4- methoxy naphthalene -1- yl , 5- methoxy naphthalene -1- yl , 6- methoxy naphthalene -1- yl , 7- methoxy naphthalene -1- yl , 8- methoxy naphthalene -1- yl , 2, 4- dimethoxy phenyl , 2, 4, 6- trimethoxy phenyl , 4, 5- dimethoxy naphthalene -1- yl , 4, 6- dimethoxy naphthalene -1- yl , 4, 8- dimethoxy naphthalene -1- yl , 1- methoxy indene -2- yl , 1- methoxy indene -3- yl , 1- methoxy indene -4- yl , 1- methoxy indene -5- yl , 1- methoxy indene -6- yl , 1- methoxy indene -7- yl , 1, 3- dimethoxy indene -2- yl , 1, 2- dimethoxy indene -3- yl , 1, 3- dimethoxy indene -4- yl , 2, 3- dimethoxy indene -5- yl , 1, 4- dimethoxy indene -6- yl , 1, 4- dimethoxy indene -7- yl etc as aryl group which is substituted with above-mentioned lower alkoxy group .

イル等が挙げられる。

[0024]

上記の「ハロゲン化低級アルキル」としては、例えばフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、1-フルオロエチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリブロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、1,2-ジフルオロエチル、1,2-ジクロロエチル、1,2-ジブロモエチル、1,1-ジフルオロエチル、1,1-ジクロロエチル、1,1-ジブロモエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロエチル、2,2-ジブロモエチル等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルキル基が挙げられる。

よって、上記のハロゲン化低級アルキル基で置換されたアリール基としては、例えばハロメチルで置換されたアリール基(例、フルオロメチルで置換されたフェニル基、フルオロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、クロロメチルで置換されたフェニル基、クロロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、ブロモメチルで置換されたフェニル基、ブロモメチルで置換されたナフタレン-1-イル等)、2-ハロエチルで置換されたアリール基(例、2-フルオロエチルで置換されたフェニル基、2-フルオロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、2-クロロエチルで置換されたフェニル基、2-クロロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、2-ブロモエチルで置換されたフェニル基、2-ブロモエチルで置換されたナフタレン-1-イル等)、1-ハロエチルで置換されたアリール基(例、1-フルオロエチルで置換されたフェニル基、1-フルオロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロエチルで置換されたフェニル基、1-クロロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、1-ブロモエチルで置換されたフェニル基、1-ブロモエチルで置換されたナフタレン-1-イル等)、トリハロメチルで置換されたアリール基(例、トリフルオロメチルで置換されたフェニル基、トリフルオロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、トリクロロメチルで置換されたフェニル基、トリクロロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、トリブロモメチルで置換されたフェニル基、トリブロモメチルで置換されたナフタレン-1-イル等)等が挙げられる。

それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。

[0024]

Description above "halogenated lower alkyl " as, you can list lower alkyl group of aforementioned definition which is substituted with for example fluoromethyl, chloromethyl, bromomethyl, 2- fluoro ethyl, 2- chloroethyl, 2- bromoethyl, 1- fluoro ethyl, 1- chloroethyl, 1- bromoethyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, tribromo methyl, difluoromethyl, dichloro methyl, dibromo methyl, 1, 2- difluoro ethyl, 1, 2- dichloro ethyl, 1, 2- dibromoethyl, 1, 1- difluoro ethyl, 1, 1- dichloro ethyl, 1, 1- dibromoethyl, 2, 2- difluoro ethyl, 2, 2- dichloro ethyl, 2, 2- dibromoethyl or other, halogen.

Depending, aryl group which is substituted with for example halomethyl as aryl group which is substituted with above-mentioned halogenated lower alkyl group, (Example and naphthalene -1- yl etc which is substituted with phenyl group, bromomethyl which is substituted with naphthalene -1- yl, bromomethyl which is substituted with phenyl group, chloromethyl which is substituted with naphthalene -1- yl, chloromethyl which is substituted with phenyl group, fluoromethyl which is substituted with fluoromethyl), aryl group which is substituted with 2 -haloethyl (Example and naphthalene -1- yl etc which is substituted with phenyl group, 2- bromoethyl which is substituted with naphthalene -1- yl, 2- bromoethyl which is substituted with phenyl group, 2- chloroethyl which is substituted with naphthalene -1- yl, 2- chloroethyl which is substituted with phenyl group, 2- fluoro ethyl which is substituted with 2 -fluoro ethyl), aryl group which is substituted with 1 -haloethyl (Example and naphthalene -1- yl etc which is substituted with phenyl group, 1- bromoethyl which is substituted with naphthalene -1- yl, 1- bromoethyl which is substituted with phenyl group, 1- chloroethyl which is substituted with naphthalene -1- yl, 1- chloroethyl which is substituted with phenyl group, 1- fluoro ethyl which is substituted with 1 -fluoro ethyl), you can list aryl group (Example and naphthalene -1- yl etc which is substituted with phenyl group, tribromo methyl which is substituted with naphthalene -1- yl, tribromo methyl which is substituted with phenyl group, trichloromethyl which is substituted with naphthalene -1- yl, trichloromethyl which is substituted with phenyl group, trifluoromethyl which is substituted with trifluoromethyl) etc which is substituted with trihalomethyl.

As respective substituted position, if it is a phenyl group, if 2 -, 3 -, 4 -, is the naphthalene -1- yl, 2 -, 3 -, 4 -, 5 -, 6 -, 7 -, 8 - it is and especially is not limited.

【0025】

インデニルであれば、

例えば 1-フルオロメチルインデン-2-イル、

1-クロロメチルインデン-2-イル、

1-ブロモメチルインデン-2-イル、

1-(2-フルオロエチル)インデン-2-イル、

1-(2-クロロエチル)インデン-2-イル、

1-(2-ブロモエチル)インデン-2-イル、

1-(1-フルオロエチル)インデン-2-イル、

1-(1-クロロエチル)インデン-2-イル、

1-(1-ブロモエチル)インデン-2-イル、

1-トリフルオロメチルインデン-2-イル、

1-トリクロロメチルインデン-2-イル、

1-トリブロモメチルインデン-2-イル、

1-フルオロメチルインデン-3-イル、

1-クロロメチルインデン-3-イル、

1-ブロモメチルインデン-3-イル、

1-(2-フルオロエチル)インデン-3-イル、

1-(2-クロロエチル)インデン-3-イル、

1-(2-ブロモエチル)インデン-3-イル、

1-(1-フルオロエチル)インデン-3-イル、

1-(1-クロロエチル)インデン-3-イル、

1-(1-ブロモエチル)インデン-3-イル、

1-トリフルオロメチルインデン-3-イル、

1-トリクロロメチルインデン-3-イル、

1-トリブロモメチルインデン-3-イル、

1-フルオロメチルインデン-4-イル、1-クロロメチルインデン-4-イル、1-ブロモメチルインデン-4-イル、1-(2-フルオロエチル)インデン-4-イル、1-(2-クロロエチル)インデン-4-イル、1-(2-ブロモエチル)インデン-4-イル、1-(1-フルオロエチル)インデン-4-イル、1-(1-クロロエチル)インデン-4-イル、1-(1-ブロモエチル)インデン-4-イル、1-トリフルオロメチルインデン-4-イル、1-トリクロロメチルインデン-4-イル、1-トリブロモメチルインデン-4-イル、1-フルオロメチルインデン-5-イル、1-クロロメチルインデン-5-イル、1-ブロモメチルインデン-5-イル、1-(2-フルオロエチル)インデン-5-イル、1-(2-クロロエチル)インデン-5-イル、1-(2-ブロモエチル)インデン-5-イル、1-(1-フルオロエチル)イ

[0025]

If it is a indenyl ,

for example 1- fluoromethyl indene -2- yl ,

1 -chloromethyl indene -2- yl ,

1 -bromomethyl indene -2- yl ,

1 - (2 -fluoro ethyl ) indene -2- yl ,

1 - (2 -chloroethyl ) indene -2- yl ,

1 - (2 -bromoethyl ) indene -2- yl ,

1 - (1 -fluoro ethyl ) indene -2- yl ,

1 - (1 -chloroethyl ) indene -2- yl ,

1 - (1 -bromoethyl ) indene -2- yl ,

1 -trifluoromethyl indene -2- yl ,

1 -trichloromethyl indene -2- yl ,

1 -tribromo methyl indene -2- yl ,

1 -fluoromethyl indene -3- yl ,

1 -chloromethyl indene -3- yl ,

1 -bromomethyl indene -3- yl ,

1 - (2 -fluoro ethyl ) indene -3- yl ,

1 - (2 -chloroethyl ) indene -3- yl ,

1 - (2 -bromoethyl ) indene -3- yl ,

1 - (1 -fluoro ethyl ) indene -3- yl ,

1 - (1 -chloroethyl ) indene -3- yl ,

1 - (1 -bromoethyl ) indene -3- yl ,

1 -trifluoromethyl indene -3- yl ,

1 -trichloromethyl indene -3- yl ,

1 -tribromo methyl indene -3- yl ,

1 -fluoromethyl indene -4- yl , 1 -chloromethyl indene -4- yl , 1 -bromomethyl indene -4- yl , 1 - (2 -fluoro ethyl ) indene -4- yl , 1 - (2 -chloroethyl ) indene -4- yl , 1 - (2 -bromoethyl ) indene -4- yl , 1 - (1 -fluoro ethyl ) indene -4- yl , 1 - (1 -chloroethyl ) indene -4- yl , 1 - (1 -bromoethyl ) indene -4- yl , 1 -trifluoromethyl indene -4- yl , 1 -trichloromethyl indene -4- yl , 1 -tribromo methyl indene -4- yl , 1 -fluoromethyl indene -5-yl , 1 -chloromethyl indene -5-yl , 1 -bromomethyl indene -5-yl , 1 - (2 -fluoro ethyl ) indene -5-yl , 1 - (2 -chloroethyl ) indene -5-yl , 1 - (2 -bromoethyl ) indene -5-yl , 1 - (1 -fluoro ethyl ) indene -5-yl , 1 - (1 -chloroethyl ) indene -5-yl , 1 - (1 -bromoethyl ) indene -5-yl , 1 -trifluoromethyl indene -5-yl , 1 -trichloromethyl indene -5-yl , 1 -tribromo methyl indene -5-yl , 1 -fluoromethyl indene

ンデン-5-イル、1-(1-クロロエチル)インデン-5-イル、1-(1-ブロモエチル)インデン-5-イル、1-トリフルオロメチルインデン-5-イル、1-トリクロロメチルインデン-5-イル、1-トリブロモメチルインデン-5-イル、1-フルオロメチルインデン-6-イル、1-クロロメチルインデン-6-イル、1-ブロモメチルインデン-6-イル、1-(2-フルオロエチル)インデン-6-イル、1-(2-クロロエチル)インデン-6-イル、1-(2-ブロモエチル)インデン-6-イル、1-(1-フルオロエチル)インデン-6-イル、1-(1-クロロエチル)インデン-6-イル、1-(1-ブロモエチル)インデン-6-イル、1-トリフルオロメチルインデン-6-イル、1-トリブロモメチルインデン-6-イル、1-フルオロメチルインデン-7-イル、1-クロロメチルインデン-7-イル、1-ブロモメチルインデン-7-イル、1-(2-フルオロエチル)インデン-7-イル、1-(2-クロロエチル)インデン-7-イル、1-(2-ブロモエチル)インデン-7-イル、1-(1-フルオロエチル)インデン-7-イル、1-(1-クロロエチル)インデン-7-イル、1-(1-ブロモエチル)インデン-7-イル、1-トリフルオロメチルインデン-7-イル、1-トリクロロメチルインデン-7-イル、1-トリブロモメチルインデン-7-イル等が挙げられ、これらに限定されない。

## 【0026】

上記の「ハロゲン化低級アルケニル基」としては、例えば 3-フルオロ-1-プロペニル、3-クロロ-1-プロペニル、3-ブロモ-1-プロペニル、4-フルオロ-2-ブテニル、4-クロロ-2-ブテニル、4-ブロモ-2-ブテニル、1-フルオロ-2-ブテニル、1-クロロ-2-ブテニル、1-ブロモ-2-ブテニル等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルケニル基が挙げられる。

よって、上記のハロゲン化低級アルケニル基で置換されたアリール基としては、例えば 3-ハロ-1-プロペニルで置換されたアリール基(例、3-フルオロ-1-プロペニルで置換されたフェニル基、3-フルオロ-1-プロペニルで置換されたナフタレン-1-イル、3-クロロ-1-プロペニルで置換されたフェニル基、3-クロロ-1-プロペニルで置換されたナフタレン-1-イル、3-ブロモ-1-プロペニルで置換されたフェニル基、3-ブロモ-1-プロペニルで置換されたナフタレン-1-イル等)、4-ハロ-2-ブテニルで置換されたアリール基(例、4-フルオロ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、4-フルオロ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、4-クロロ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、4-クロロ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、4-ブロモ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、4-ブロモ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル等)、1-ハロ-2-ブテニルで置換されたアリール基

-6-yl, 1-chloromethyl indene -6-yl, 1-bromomethyl indene -6-yl, 1-(2-fluoro ethyl) indene -6-yl, 1-(2-chloroethyl) indene -6-yl, 1-(2-bromoethyl) indene -6-yl, 1-(1-fluoro ethyl) indene -6-yl, 1-(1-chloroethyl) indene -6-yl, 1-(1-bromoethyl) indene -6-yl, 1-trifluoromethyl indene -6-yl, 1-trichloromethyl indene -6-yl, 1-tribromo methyl indene -6-yl, 1-fluoromethyl indene -7-yl, 1-chloromethyl indene -7-yl, 1-bromomethyl indene -7-yl, 1-(2-fluoro ethyl) indene -7-yl, 1-(2-chloroethyl) indene -7-yl, 1-(2-bromoethyl) indene -7-yl, 1-(1-fluoro ethyl) indene -7-yl, 1-(1-chloroethyl) indene -7-yl, 1-(1-bromoethyl) indene -7-yl, 1-trifluoromethyl indene -7-yl, 1-trichloromethyl indene -7-yl, 1-tribromo methyl indene -7-yl etc listing, is not limited in these.

## 【0026】

Description above "halogenation lower alkenyl group" as, you can list lower alkenyl group of aforementioned definition which is substituted with for example 3-fluoro -1-propenyl, 3-chloro -1-propenyl, 3-bromo -1-propenyl, 4-fluoro -2-butenyl, 4-chloro -2-butenyl, 4-bromo -2-butenyl, 1-fluoro -2-butenyl, 1-chloro -2-butenyl, 1-bromo -2-butenyl or other, halogen.

Depending, aryl group which is substituted with for example 3-halo 1-propenyl as aryl group which is substituted with above-mentioned halogenation lower alkenyl group, (Example and naphthalene -1-yl etc which is substituted with phenyl group, 3-bromo -1-propenyl which is substituted with naphthalene -1-yl, 3-bromo -1-propenyl which is substituted with phenyl group, 3-chloro -1-propenyl which is substituted with naphthalene -1-yl, 3-chloro -1-propenyl which is substituted with phenyl group, 3-fluoro -1-propenyl which is substituted with 3-fluoro -1-propenyl), aryl group which is substituted with 4-halo 2-butenyl (Example and naphthalene -1-yl etc which is substituted with phenyl group, 4-bromo -2-butenyl which is substituted with naphthalene -1-yl, 4-bromo -2-butenyl which is substituted with phenyl group, 4-chloro -2-butenyl which is substituted with naphthalene -1-yl, 4-chloro -2-butenyl which is substituted with phenyl group, 4-fluoro -2-butenyl which is substituted with 4-fluoro -2-butenyl), you can list aryl group

(例、1-フルオロ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、1-フルオロ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、1-クロロ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、1-ブロモ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、1-ブロモ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル等)等が挙げられる。

それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。

インデニルであれば、

例えば、

1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-2-イル、  
1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-2-イル、  
1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-2-イル、  
1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、  
1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、  
1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-2-イル、  
1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、  
1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、  
1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-2-イル、  
1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-3-イル、  
1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-3-イル、  
1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-3-イル、  
1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、  
1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、  
1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-3-イル、  
1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、  
1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、  
1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-5-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-5-イル、1-(3-ブロモ-1-

(Example and naphthalene -1- yl etc which is substituted with phenyl group , 1- bromo -2- butenyl which is substituted with naphthalene -1- yl , 1- bromo -2- butenyl which is substituted with phenyl group , 1- chloro -2- butenyl which is substituted with naphthalene -1- yl , 1- chloro -2- butenyl which is substituted with phenyl group , 1- fluoro -2- butenyl which is substituted with 1- fluoro -2- butenyl ) etc which is substituted with 1- halo 2- butenyl .

As respective substituted position, if it is a phenyl group, if 2-, 3-, 4-, is the naphthalene -1-yl, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- it is and especially is not limited.

If it is a indenyl ,

for example

1 - (3 -fluoro -1- propenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (3 -chloro -1- propenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (3 -bromo -1- propenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (4 -fluoro -2- butenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (4 -chloro -2- butenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (4 -bromo -2- butenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (1 -fluoro -2- butenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (1 -chloro -2- butenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (1 -bromo -2- butenyl ) indene -2- yl ,  
1 - (3 -fluoro -1- propenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (3 -chloro -1- propenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (3 -bromo -1- propenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (4 -fluoro -2- butenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (4 -chloro -2- butenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (4 -bromo -2- butenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (1 -fluoro -2- butenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (1 -chloro -2- butenyl ) indene -3- yl ,  
1 - (1 -bromo -2- butenyl ) indene -3- yl , 1- (3 -fluoro -1- propenyl ) indene -4- yl , 1- (3 -chloro -1- propenyl ) indene -4- yl , 1- (3 -bromo -1- propenyl ) indene -4- yl , 1- (4 -fluoro -2- butenyl ) indene -4- yl , 1- (4 -chloro -2- butenyl ) indene -4- yl , 1- (4 -bromo -2- butenyl ) indene -4- yl , 1- (1 -fluoro -2- butenyl ) indene -4- yl , 1- (1 -chloro -2- butenyl ) indene -4- yl , 1- (1 -bromo -2- butenyl ) indene -4- yl , 1- (3 -fluoro -1- propenyl ) indene -5-yl , 1- (3 -chloro -1- propenyl ) indene -5-yl , 1- (3 -bromo -1- propenyl ) indene -5-yl , 1- (4 -fluoro -2- butenyl ) indene -5-yl , 1- (4 -chloro -2- butenyl ) indene -5-yl , 1- (4 -bromo -2- butenyl ) indene -5-yl , 1- (1



プロペニル)インデン-5-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-6-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-6-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-6-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-7-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-7-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-7-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

## 【0027】

上記の「ハロゲン化低級アルコキシ基」としては、例えばフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、1-フルオロエトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルコキシ基等が挙げられる。

よって、上記のハロゲン化低級アルコキシ基で置換されたアリール基としては、例えばハロメトキシで置換されたアリール基(例、フルオロメトキシで置換されたフェニル基、フルオロメトキシで置換されたナフタレン-1-イル、クロロメトキシで置換されたフェニル基、クロロメトキシで置換されたナフタレン-1-イル、ブロモメトキシで置換されたフェニル基、ブロモメトキシで置換されたナフタレン-1-イル等)、ハロエトキシで置換されたアリール基(例、1-フルオロエトキシで置換されたフェニル基、1-フルオロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロエトキシで置換されたフェニル基、1-クロロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、1-ブロモエトキシで置換されたフェニル基、1-ブロモエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、2-フルオロエトキシで置換されたフェニル基、2-フルオロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、2-クロロエトキシで置換されたフェニル基、2-クロロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、2-ブロモエトキシで置換されたフェ

-fluoro-2- butenyl ) indene -5-yl , 1- (1 -chloro -2- butenyl ) indene -5-yl , 1- (1 -bromo -2- butenyl ) indene -5-yl , 1- (3 -fluoro -1- propenyl ) indene -6-yl , 1- (3 -chloro -1- propenyl ) indene -6-yl , 1- (3 -bromo -1- propenyl ) indene -6-yl , 1- (4 -fluoro -2- butenyl ) indene -6-yl , 1- (4 -chloro -2- butenyl ) indene -6-yl , 1- (4 -bromo -2- butenyl ) indene -6-yl , 1- (1 -fluoro -2- butenyl ) indene -6-yl , 1- (1 -chloro -2- butenyl ) indene -6-yl , 1- (1 -bromo -2- butenyl ) indene -6-yl , 1- (3 -fluoro -1- propenyl ) indene -7-yl , 1- (3 -chloro -1- propenyl ) indene -7-yl , 1- (4 -fluoro -2- butenyl ) indene -7-yl , 1- (4 -chloro -2- butenyl ) indene -7-yl , 1- (4 -bromo -2- butenyl ) indene -7-yl , 1- (1 -fluoro -2- butenyl ) indene -7-yl , 1- (1 -chloro -2- butenyl ) indene -7-yl , 1- (1 -bromo -2- butenyl ) indene -7-yl etc, but it is not limited in these.

## [0027]

Description above "halogenation lower alkoxy group " as, you can list lower alkoxy group etc of theaforementioned definition which is substituted with for example fluoro methoxy , chloro methoxy , bromo methoxy , 1- fluoro ethoxy , 1- chloro ethoxy , 1- bromo ethoxy , 2- fluoro ethoxy , 2- chloro ethoxy , 2- bromo ethoxy or other , halogen .

Depending, aryl group which is substituted with for example halo- methoxy as aryl group which is substituted with above-mentioned halogenation lower alkoxy group , (Example and naphthalene -1- yl etc which is substituted with phenyl group , bromo methoxy which is substituted with naphthalene -1- yl , bromo methoxy which is substituted with phenyl group , chloro methoxy which is substituted with naphthalene -1- yl , chloro methoxy which is substituted with phenyl group , fluoro methoxy which is substituted with fluoro methoxy ), you can list aryl group (Example and naphthalene -1- yl etc which is substituted with phenyl group , 2- bromo ethoxy which is substituted with naphthalene -1- yl , 2- bromo ethoxy which is substituted with phenyl group , 2- chloro ethoxy which is substituted with naphthalene -1- yl , 2- chloro ethoxy which is substituted with phenyl group , 2- fluoro ethoxy which is substituted with naphthalene -1- yl , 2- fluoro ethoxy which is substituted with the phenyl group , 1- bromo ethoxy which is substituted with naphthalene -1- yl , 1- bromo ethoxy which is substituted with phenyl group , 1- chloro ethoxy which is substituted with naphthalene -1- yl , 1-

chloro ethoxy which is substituted with phenyl group , 1-fluoro ethoxy which is substituted with 1 -fluoro ethoxy ) etc which is substituted with halo- ethoxy .

As respective substituted position , if it is a phenyl group , if 2 -, 3 -, 4 -, is the naphthalene -1- yl , 2 -, 3 -, 4 -, 5 -, 6 -, 7 -, 8 - it is and especially is not limited.

If it is a indenyl ,

for example

1 -fluoro methoxy indene -2- yl ,

1 -chloro methoxy indene -2- yl ,

1 -bromo methoxy indene -2- yl ,

1 - (1 -fluoro ethoxy ) indene -2- yl ,

1 - (1 -chloro ethoxy ) indene -2- yl .

1 - (1 -bromo ethoxy ) indene -2- yl ,

1 - (2 -fluoro ethoxy ) indene -2- yl ,

1 - (2 -chloro ethoxy ) indene -2- yl .

1 - (2 -bromo ethoxy ) indene -2- yl ,

1-fluoro methoxy indene -3-yl, 1-chloro methoxy indene -3-yl, 1-bromo methoxy indene -3-yl, 1-(1-fluoro ethoxy) indene -3-yl, 1-(1-chloro ethoxy) indene -3-yl, 1-(1-bromo ethoxy) indene -3-yl, 1-(2-fluoro ethoxy) indene -3-yl, 1-(2-chloro ethoxy) indene -3-yl, 1-(2-bromo ethoxy) indene -3-yl, 1-fluoro methoxy indene -4-yl, 1-chloro methoxy indene -4-yl, 1-bromo methoxy indene -4-yl, 1-(1-fluoro ethoxy) indene -4-yl, 1-(1-chloro ethoxy) indene -4-yl, 1-(1-bromo ethoxy) indene -4-yl, 1-(2-fluoro ethoxy) indene -4-yl, 1-(2-chloro ethoxy) indene -4-yl, 1-(2-bromo ethoxy) indene -4-yl, 1-fluoro methoxy indene -5-yl, 1-chloro methoxy indene -5-yl, 1-bromo methoxy indene -5-yl, 1-(1-fluoro ethoxy) indene -5-yl, 1-(1-chloro ethoxy) indene -5-yl, 1-(1-bromo ethoxy) indene -5-yl, 1-(2-fluoro ethoxy) indene -5-yl, 1-(2-chloro ethoxy) indene -5-yl, 1-(2-bromo ethoxy) indene -5-yl, 1-fluoro methoxy indene -6-yl, 1-chloro methoxy indene -6-yl, 1-bromo methoxy indene -6-yl, 1-(1-fluoro ethoxy) indene -6-yl, 1-(1-chloro ethoxy) indene -6-yl, 1-(1-bromo ethoxy) indene -6-yl, 1-(2-fluoro ethoxy) indene -6-yl, 1-(2-chloro ethoxy) indene -6-yl, 1-(2-bromo ethoxy) indene -6-yl, 1-fluoro methoxy indene -7-yl, 1-chloro methoxy indene -7-yl, 1-bromo methoxy indene -7-yl, 1-(1-fluoro ethoxy) indene -7-yl, 1-(1-chloro ethoxy) indene -7-yl, 1-(1-bromo ethoxy) indene -7-yl, 1-(2-fluoro ethoxy) indene -7-yl, 1-(2-chloro ethoxy) indene -7-yl, 1-(2-bromo ethoxy) You can list indene -7-yl etc, but it is not limited in these.

ル、1-フルオロメトキシインデン-7-イル、1-クロロメトキシインデン-7-イル、1-ブロモメトキシインデン-7-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-7-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-7-イル、1-(1-ブロモエトキシ)インデン-7-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-7-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-7-イル、1-(2-ブロモエトキシ)インデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

【0028】

上記の「アリール基」は、前記定義のアリール基、例えばフェニル、インデニル、ナフチル(1-ナフチル、2-ナフチル等)、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル、フルオレニル(9-フルオレニル、1-フルオレニル等)等の炭素数6ないし20のアリール基等である。

よって、上記のアリール基で置換されたアリール基としては、例えば2-ビフェニルイル、3-ビフェニルイル、4-ビフェニルイル、2-(1-ナフチル)フェニル、3-(1-ナフチル)フェニル、4-(1-ナフチル)フェニル、3-フェニルナフタレン-1-イル、4-フェニルナフタレン-1-イル、5-フェニルナフタレン-1-イル、6-フェニルナフタレン-1-イル、7-フェニルナフタレン-1-イル、8-フェニルナフタレン-1-イル等が挙げられる。

【0029】

上記のヒドロキシ基で置換されたアリール基としては、例えば2-ヒドロキシフェニル、2-ヒドロキシナフタレン-1-イル、3-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシナフタレン-1-イル、4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシナフタレン-1-イル、5-ヒドロキシナフタレン-1-イル、6-ヒドロキシナフタレン-1-イル、7-ヒドロキシナフタレン-1-イル、8-ヒドロキシナフタレン-1-イル、1-ヒドロキシインデン-1-イル、1-ヒドロキシインデン-2-イル、1-ヒドロキシインデン-3-イル、1-ヒドロキシインデン-4-イル、1-ヒドロキシインデン-5-イル、1-ヒドロキシインデン-6-イル、1-ヒドロキシインデン-7-イル、1,4-ジヒドロキシインデン-1-イル、1,5-ジヒドロキシインデン-2-イル、2,5-ジヒドロキシインデン-3-イル、1,3-ジヒドロキシインデン-4-イル、1,3-ジヒドロキシインデン-5-イル、2,4-ジヒドロキシインデン-6-イル、1,4-ジヒドロキシインデン-7-イル等が挙げられる。

【0030】

上記の「アシル基」とは、後述する「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「アシル基」と同意義である。

上記のアシル基で置換されたアリール基としては、例えば2-アセチルフェニル、2-アセチルナフタレン-1-イル、3-アセチルフェニル、3-アセチル

【0028】

Above-mentioned "aryl group", aryl group, for example phenyl, indenyl, naphthyl of aforementioned definition (1-naphthyl, 2-naphthyl etc), is anthryl, phenanthryl, acenaphthylene, fluorenyl (9-fluorenyl, 1-fluorenyl etc) or other carbon number 6 to 20 aryl group etc.

Depending, you can list for example 2-biphenyl yl, 3-biphenyl yl, 4-biphenyl yl, 2-(1-naphthyl) phenyl, 3-(1-naphthyl) phenyl, 4-(1-naphthyl) phenyl, 3-phenyl naphthalene-1-yl, 4-phenyl naphthalene-1-yl, 5-phenyl naphthalene-1-yl, 6-phenyl naphthalene-1-yl, 7-phenyl naphthalene-1-yl, 8-phenyl naphthalene-1-yl etc as aryl group which is substituted with above-mentioned aryl group.

【0029】

You can list for example 2-hydroxyphenyl, 2-hydroxy naphthalene-1-yl, 3-hydroxyphenyl, 3-hydroxy naphthalene-1-yl, 4-hydroxyphenyl, 4-hydroxy naphthalene-1-yl, 5-hydroxy naphthalene-1-yl, 6-hydroxy naphthalene-1-yl, 7-hydroxy naphthalene-1-yl, 8-hydroxy naphthalene-1-yl, 1-hydroxy indene-1-yl, 1-hydroxy indene-2-yl, 1-hydroxy indene-3-yl, 1-hydroxy indene-4-yl, 1-hydroxy indene-5-yl, 1-hydroxy indene-6-yl, 1-hydroxy indene-7-yl, 1,4-dihydroxy indene-1-yl, 1,5-dihydroxy indene-2-yl, 2,5-dihydroxy indene-3-yl, 1,3-dihydroxy indene-4-yl, 1,3-dihydroxy indene-5-yl, 2,4-dihydroxy indene-6-yl, 1,4-dihydroxy indene-7-yl etc as aryl group which is substituted with the above-mentioned hydroxyl group.

【0030】

It is an above-mentioned "acyl group" with, as substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group" which it mentions later "acyl group" with same meaning.

You can list for example 2-acetyl phenyl, 2-acetyl naphthalene-1-yl, 3-acetyl phenyl, 3-acetyl naphthalene-1-yl, 4-acetyl phenyl, 4-acetyl naphthalene-1-yl,

ナフタレン-1-イル、4-アセチルフェニル、4-アセチルナフタレン-1-イル、5-アセチルナフタレン-1-イル、6-アセチルナフタレン-1-イル、7-アセチルナフタレン-1-イル、8-アセチルナフタレン-1-イル、1-アセチルインデン-1-イル、1-アセチルインデン-2-イル、1-アセチルインデン-3-イル、1-アセチルインデン-4-イル、1-アセチルインデン-5-イル、1-アセチルインデン-6-イル、1-アセチルインデン-7-イル、1-アセチルインデン-2-イル、3-アセチルインデン-2-イル、4-アセチルインデン-2-イル、5-アセチルインデン-2-イル、6-アセチルインデン-2-イル、7-アセチルインデン-2-イル、1-アセチルインデン-3-イル、2-アセチルインデン-3-イル、4-アセチルインデン-3-イル、5-アセチルインデン-3-イル、6-アセチルインデン-3-イル、7-アセチルインデン-3-イル、1-アセチルインデン-4-イル、2-アセチルインデン-4-イル、3-アセチルインデン-4-イル、5-アセチルインデン-4-イル、6-アセチルインデン-4-イル、7-アセチルインデン-4-イル、等が挙げられるが、これらに限定されない。

## 【0031】

上記のアミノ基で置換されたアリール基としては、例えば 2-アミノフェニル、2-アミノナフタレン-1-イル、3-アミノフェニル、3-アミノナフタレン-1-イル、4-アミノフェニル、4-アミノナフタレン-1-イル、5-アミノナフタレン-1-イル、6-アミノナフタレン-1-イル、7-アミノナフタレン-1-イル、8-アミノナフタレン-1-イル等が挙げられる。

## 【0032】

G<sup>1</sup> 中の A は、好ましくは酸素原子である。

G<sup>1</sup> 中の R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> で示される「ハロゲン原子」は、前記と同意義である。

G<sup>1</sup> 中の R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> で示される「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の脂肪族炭化水素基とは、直鎖状または分枝状の脂肪族炭化水素基(アルキル基、アルケニル基、アルキニル基等)を意味する。

## 【0033】

上記の「脂肪族炭化水素基」のアルキル基の例としては、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、イソヘキシル、ヘプチル、オクチル、デシル、テトラヒドロゲラニル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、オクタデシル、ノナデシル、エイコサニル等の直鎖状または分枝状の炭素数 1 ないし 20 のアルキル基等が挙げられ

5-acetyl naphthalene -1- yl , 6-acetyl naphthalene -1- yl , 7-acetyl naphthalene -1- yl , 8-acetyl naphthalene -1- yl , 1-acetyl indene -1- yl , 1- acetyl indene -2- yl , 1- acetyl indene -3- yl , 1- acetyl indene -4- yl , 1- acetyl indene -5-yl , 1- acetyl indene -6-yl , 1- acetyl indene -7-yl , 1- acetyl indene -2- yl , 3- acetyl indene -2- yl , 4- acetyl indene -2- yl , 5-acetyl indene -2- yl , 6-acetyl indene -2- yl , 7-acetyl indene -2- yl , 1- acetyl indene -3- yl , 2- acetyl indene -3- yl , 4- acetyl indene -3- yl , 5-acetyl indene -3- yl , 6-acetyl indene -3- yl , 7-acetyl indene -3- yl , 1- acetyl indene -4- yl , 2- acetyl indene -4- yl , 3- acetyl indene -4- yl , 5-acetyl indene -4- yl , 6-acetyl indene -4- yl , 7-acetyl indene -4- yl , etc, as aryl group which is substituted with theabove-mentioned acyl group , but it is not limited in these.

## 【0031】

You can list for example 2- amino phenyl , 2- amino naphthalene -1- yl , 3- amino phenyl , 3- amino naphthalene -1- yl , 4- amino phenyl , 4- amino naphthalene -1- yl , 5-amino naphthalene -1- yl , 6-amino naphthalene -1- yl , 7-amino naphthalene -1- yl , 8-amino naphthalene -1- yl etc as aryl group which is substituted with theabove-mentioned amino group .

## 【0032】

A in G<sup>1</sup> is preferably oxygen atom .

"halogen atom " which is shown with R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> is same meaningas description above.

aliphatic hydrocarbon group of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " which is shown with R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup>, the aliphatic hydrocarbon group (alkyl group , alkenyl group , alkynyl group etc) of straight chain or branched is meant.

## 【0033】

As example of alkyl group of above-mentioned "aliphatic hydrocarbon group " , you can list the carbon number 1 to 20 alkyl group etc of for example methyl , ethyl , propyl , isopropyl , butyl , isobutyl , s-butyl , t- butyl , pentyl , isopentyl , neopentyl , t- pentyl , 1- ethyl propyl , hexyl , isohexyl , heptyl , octyl , decyl , tetrahydro geranyl , dodecyl , tridecyl , tetradecyl , hexadecyl , octadecyl , nonadecyl , eicosanyl or other straight chain or branched .

る。

より好ましくは、炭素数 1 ないし 10 のアルキル基である。

【0034】

上記の「脂肪族炭化水素基」のアルケニル基の例としては、例えばビニル、アリル、イソプロペニル、1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-ヘプテニル、1-オクテニル、ゲラニル、1-デセニル、1-テトラデセニル、1-オクタデセニル、9-オクタデセニル、1-エイコセニル、3,7,11,15-テトラメチル-1-ヘキサデセニル等の直鎖状または分枝状の炭素数 2 ないし 20 のアルケニル基等が挙げられる。

より好ましくは、炭素数 2 ないし 8 のアルケニル基である。

上記の「脂肪族炭化水素基」のアルキニル基の例としては、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、2-ペンテン-4-イニル等の炭素数 2 ないし 20 のアルキニル基等が挙げられる。

該アルキニルはさらに二重結合を有していてもよい。

より好ましくは、炭素数 2 ないし 8 のアルキニル基である。

【0035】

G<sup>1</sup> 中の R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> で示される「(置換されていてもよい脂肪族炭化水素基)-O-」とは酸素原子に前記定義した脂肪族炭化水素基が結合している基を意味し、例えばアルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基等を意味する。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の好ましい具体例としては、例えばハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ、低級アルキルカルボニルオキシ、カルボキシル基、置換または非置換のカルバモイル基、シアノ基、置換または非置換のアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、置換または非置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、置換または非置換の単環式または縮合多環式アリール基、置換または非置換の複素環基、アシル基等が挙げられ  
z

more preferably, carbon number 1 or it is a alkyl group of 10.

【0034】

As example of alkenyl group of above-mentioned "aliphatic hydrocarbon group", you can list the carbon number 2 to 20 alkenyl group etc of for example vinyl, allyl, isopropenyl, 1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-heptenyl, 1-octenyl, geranyl, 1-decenyl, 1-tetradecenyl, 1-octadecenyl, 9-octadecenyl, 1-eicosenyl, 3, 7, 11, 15-tetramethyl-1-hexadecenyl or other straight chain or branched.

more preferably, carbon number 2 or it is a alkenyl group of 8.

As example of alkynyl group of above-mentioned "aliphatic hydrocarbon group", you can list the for example ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 2-pentene-4-enyl or other carbon number 2 to 20 alkynyl group etc.

said alkynyl furthermore has been allowed to have possessed double bond.

more preferably, carbon number 2 or it is a alkynyl group of 8.

【0035】

It is shown with R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup>, " (optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group) -O-" with description above the basis which aliphatic hydrocarbon group which is defined has connected is meant in the oxygen atom, for example alkoxy group, alkenyl oxy group, alkynyl oxy group etc is meant.

You can list monocyclic of alicyclic hydrocarbon group, substituted or unsubstituted of saturated or unsaturated of amino group, amidino group, azido group, nitro group, nitroso group, mercapto group, lower alkyl thio group, sulfo group, substituted or unsubstituted of the carbamoyl group, cyano group, substituted or unsubstituted of for example halogen atom, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy, lower alkyl carbonyl oxy, carboxyl group, substituted or unsubstituted or heterocyclic group, acyl group etc of condensed polycyclic aryl group, substituted or unsubstituted as embodiment where substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group" is desirable.

る。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の数は1個~5個、好ましくは1個~3個である。

置換基の位置は特に限定されない。

【0036】

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「ハロゲン」とは、前記と同意義である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルコキシ基」は、前記と同意義である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルケニルオキシ」としては、例えばビニルオキシ、アリルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-メチル-1-プロペニルオキシ、1-ブテニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、2-エチル-1-ブテニルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ、1-ペンテニルオキシ、2-ペンテニルオキシ、3-ペンテニルオキシ、4-ペンテニルオキシ、4-メチル-3-ペンテニルオキシ等の炭素数2ないし7のアルケニルオキシが挙げられる。

【0037】

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルキルカルボニルオキシ」としては、例えばメチルカルボニルオキシ、エチルカルボニルオキシ、プロピルカルボニルオキシ、イソプロピルカルボニルオキシ、ブチルカルボニルオキシ、イソブチルカルボニルオキシ、tert-ブチルカルボニルオキシ、ペンチルカルボニルオキシ、イソペンチルカルボニルオキシ、ネオペンチルカルボニルオキシ、tert-ペンチルカルボニルオキシ、ヘキシルカルボニルオキシ等の炭素数2ないし7のアルキルカルボニルオキシが挙げられる。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換カルバモイル基」としては、例えば N-モノ低級アルキルカルバモイル基、N,N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-低級アルコキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基等が挙げられる。

【0038】

number of substituents of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " 1 - 5, is preferably 1 ~3 .

substitution position especially is not limited.

【0036】

As substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " "halogen " with, it is same meaning as description above.

"lower alkoxy group " as substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " is same meaning as description above.

As substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " for example vinyl oxy, allyl oxy, 1-propenyl oxy, 2- methyl -1- propenyl oxy, 1- butenyl oxy, 2- butenyl oxy, 3- butenyl oxy, 2- ethyl -1- butenyl oxy, 3- methyl -2- butenyl oxy, 1- pentenyl oxy, 2- pentenyl oxy, 3- pentenyl oxy, 4- pentenyl oxy, 4- methyl -3- pentenyl oxy or other carbon number 2 or you can list alkenyl oxy of 7 "lower alkenyl oxy " as.

【0037】

As substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " for example methyl carbonyl oxy, ethyl carbonyl oxy, propyl carbonyl oxy, isopropyl carbonyl oxy, butyl carbonyl oxy, isobutyl carbonyl oxy, t- butyl carbonyl oxy, pentyl carbonyl oxy, isopentyl carbonyl oxy, neopentyl carbonyl oxy, t- pentyl carbonyl oxy, hexyl carbonyl oxy or other carbon number 2 or you can list alkyl carbonyl oxy of 7 "lower alkyl carbonyl oxy " as.

As substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " you can list for example N- mono lower alkyl carbamoyl group, N, N- di lower alkyl carbamoyl group, N- hydroxy carbamoyl group, N- lower alkoxy carbamoyl group, N- hydroxy -N- lower alkyl carbamoyl group, N- lower alkoxy -N- lower alkyl carbamoyl group, N- phenyl carbamoyl group, N- substituted phenyl carbamoyl group etc "substituted carbamoyl group " as.

【0038】

上記の「N-モノ低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN-メチルカルバモイル、N-エチルカルバモイル、N-プロピルカルバモイル、N-イソプロピルカルバモイル、N-ペンチルカルバモイル、N-イソペンチルカルバモイル、N-ネオペンチルカルバモイル、N-t-ペンチルカルバモイル、N-1-エチルプロピルカルバモイル、N-ヘキシルカルバモイル等が挙げられる。

上記の「N,N-ジ低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN,N-ジメチルカルバモイル、N-エチル-N-メチルカルバモイル、N,N-ジエチルカルバモイル、N-メチル-N-プロピルカルバモイル、N-ブチル-N-メチルカルバモイル、N-ブチル-N-エチルカルバモイル、N-ブチル-N-プロピルカルバモイル、N-ブチル-N-イソプロピルカルバモイル、N,N-ジブチルカルバモイル、N-エチル-N-プロピルカルバモイル、N,N-ジプロピルカルバモイル、N-イソプロピル-N-n-プロピルカルバモイル、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル等が挙げられる。

【0039】

上記の「N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えば N-ヒドロキシ-N-メチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-エチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-プロピルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソプロピルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-sec-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-t-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ペンチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ネオペンチルカルバモイル等の炭素数2ないし7のN-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基が挙げられる。

【0040】

上記の「N-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、その全体の炭素数は3ないし13であるN-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、例えば N-メトキシ-N-メチルカルバモイル、N-メトキシ-N-エチルカルバモイル、N-メトキシ-N-プロピルカルバモイル、N-メトキシ-N-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-イソブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-sec-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-t-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-ペンチルカルバモイル、N-メトキシ-N-ネオペンチルカルバモイル等の炭素数3ないし13のN-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基が挙げられる。

Description above "N- mono lower alkyl carbamoyl group " as, as for lower alkyl being same as aforementioned definition, you can list for example N- methyl carbamoyl , N- ethyl carbamoyl , N- propyl carbamoyl , N- isopropyl carbamoyl , N- pentyl carbamoyl , N- isopentyl carbamoyl , N- neopentyl carbamoyl , N- t-pentyl carbamoyl , N- 1- ethyl propyl carbamoyl , N- hexyl carbamoyl etc.

Description above "N, N- di lower alkyl carbamoyl group " as, as for lower alkyl being same as aforementioned definition, you can list for example N, N- dimethyl carbamoyl , N- ethyl -N- methyl carbamoyl , N, N- diethyl carbamoyl , N- methyl -N- propyl carbamoyl , N- butyl -N- methyl carbamoyl , N- butyl -N- ethyl carbamoyl , N- butyl -N- propyl carbamoyl , N- butyl -N- isopropyl carbamoyl , N, N- dibutyl carbamoyl , N- ethyl -N- propyl carbamoyl , N, N- dipropyl carbamoyl , N- isopropyl -N- n- propyl carbamoyl , N- isopropyl -N- methyl carbamoyl etc.

【0039】

Description above "N- hydroxy -N- lower alkyl carbamoyl group " as, as for lower alkyl being same as aforementioned definition, for example N- hydroxy -N- methyl carbamoyl , N- hydroxy -N- ethyl carbamoyl , N- hydroxy -N- propyl carbamoyl , N- hydroxy -N- butyl carbamoyl , N- hydroxy -N- isopropyl carbamoyl , N- hydroxy -N- isobutyl carbamoyl , N- hydroxy -N- s-butyl carbamoyl , N- hydroxy -N- t-butyl carbamoyl , N- hydroxy -N- pentyl carbamoyl , N- hydroxy -N- isopentyl carbamoyl , N- hydroxy -N- neopentyl carbamoyl or other carbon number 2 or you can list N- hydroxy -N- lower alkyl carbamoyl group of 7.

【0040】

Description above "N- lower alkoxy -N- lower alkyl carbamoyl group " as, as for lower alkyl being same as aforementioned definition, carbon number of entirety is listed 3 or 13 N- lower alkoxy -N- lower alkyl carbamoyl group , for example N- methoxy -N- methyl carbamoyl , N- methoxy -N- ethyl carbamoyl , N- methoxy -N- propyl carbamoyl , N- methoxy -N- butyl carbamoyl , N- methoxy -N- isopropyl carbamoyl , N- methoxy -N- isobutyl carbamoyl , N- methoxy -N- s-butyl carbamoyl , N- methoxy -N- t-butyl carbamoyl , N- methoxy -N- pentyl carbamoyl , N- methoxy -N- isopentyl carbamoyl , N- methoxy -N- neopentyl carbamoyl etc which is.

-N-イソペンチルカルバモイル、N-メトキシ-N-ネオペンチルカルバモイル等が挙げられる。

【0041】

上記の「N-置換フェニルカルバモイル基」の置換基としては、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ基等が挙げられ、それらの意味は前記定義と同様である。

「N-置換フェニルカルバモイル基」の好ましい具体例としては、例えば(4-メチルフェニル)カルバモイル、(4-エチルフェニル)カルバモイル、(4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2,3-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,3-メトキシフェニル)カルバモイル、(2,4-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2,6-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,6-メトキシフェニル)カルバモイル、(2,4,6-トリヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,4,6-トリメトキシフェニル)カルバモイル、(2,4-ジメトキシ-6-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,6-ジメトキシ-4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(4,6-ジヒドロキシ-2-メトキシフェニル)カルバモイル、(2,6-ジヒドロキシ-4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2,3,4-トリメトキシフェニル)カルバモイル、(2,3-ジメトキシ-4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,4-ジメトキシ-3-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,3-ジヒドロキシ-4-メトキシフェニル)カルバモイル、(3,4-ジメトキシ-2-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2,4-ジヒドロキシ-3-メトキシフェニル)カルバモイル、(2,4-ジメトキシ-6-メチルフェニル)カルバモイル、(2,6-ジメトキシ-4-メチルフェニル)カルバモイル等が挙げられる。

【0042】

$R^1$ ~ $R^6$ の定義中および「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換アミノ基」としては、例えばモノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基等が挙げられる。

上記の「モノ低級アルキルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、ヘキシルアミノ等の炭素数1ないし6のモノ低級アルキルアミノ基が挙げられる。

上記の「ジ低級アルキルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、その全体の炭素数は2ないし20であるジ低級アル

【0041】

As substituent of above-mentioned "N- substituted phenyl carbamoyl group ", you can list lower alkyl , lower alkoxy , hydroxyl group etc, those meanings are similar to aforementioned definition.

You can list for example (4 -methylphenyl ) carbamoyl , (4 -ethyl phenyl ) carbamoyl , (4 -hydroxyphenyl ) carbamoyl , (4 -methoxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 3 -dihydroxy phenyl ) carbamoyl , (2 and 3 -methoxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 4 -dihydroxy phenyl ) carbamoyl , (2 and 4 -methoxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 6 -dihydroxy phenyl ) carbamoyl , (2 and 6 -methoxyphenyl ) carbamoyl , (2, 4 and 6 -trihydroxy phenyl ) carbamoyl , (2, 4 and 6 -trimethoxy phenyl ) carbamoyl , (2 and 4 -dimethoxy -6-hydroxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 6 -dimethoxy -4- hydroxyphenyl ) carbamoyl , (4 and 6 -dihydroxy -2- methoxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 6 -dihydroxy -4- methoxyphenyl ) carbamoyl , (2, 3 and 4 -trimethoxy phenyl ) carbamoyl , (2 and 3 -dimethoxy -4-hydroxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 4 -dimethoxy -3-hydroxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 3 -dihydroxy -4-methoxyphenyl ) carbamoyl , (3 and 4 -dimethoxy -2-hydroxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 4 -dihydroxy -3-methoxyphenyl ) carbamoyl , (2 and 4 -dimethoxy -6-methylphenyl ) carbamoyl etc as embodiment where "N-substituted phenyl carbamoyl group " is desirable.

【0042】

While defining  $R^{1-6}$  and as substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group " you can list the for example mono lower alkyl amino group , di lower alkyl amino group , lower alkyl carbonyl amino group etc "substituted amino group " as.

Description above "mono lower alkyl amino group " as, as for lower alkyl being same as aforementioned definition, you can list for example methylamino , ethylamino , propyl amino , isopropyl amino , butyl amino , isobutyl amino , s-butyl amino , t- butyl amino , pentyl amino , isopentyl amino , hexyl amino or other carbon number 1 to 6 mono lower alkyl amino group .

Description above "di lower alkyl amino group " as, as for lower alkyl being same as aforementioned definition, carbon number of entirety is listed 2 or 20 di lower alkyl amino



キルアミノ基、例えばジメチルアミノ、エチルメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルプロピルアミノ、エチルプロピルアミノ、イソプロピルメチルアミノ、イソプロピルエチルアミノ、ブチルメチルアミノ、ブチルエチルアミノ、イソブチルメチルアミノ、イソブチルエチルアミノ等が挙げられる。

[0043]

上記の「低級アルキルカルボニルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、プロピルカルボニルアミノ、イソプロピルカルボニルアミノ、ブチルカルボニルアミノ、イソブチルカルボニルアミノ、sec-ブチルカルボニルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ペンチルカルボニルアミノ、イソペンチルカルボニルアミノ等の炭素数2ないし7のアルキルカルボニルアミノ基が挙げられる。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルキルチオ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、ネオブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ等の炭素数1ないし6の低級アルキルチオ基が挙げられる。

[0044]

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」としては、例えばシクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカジエニル基等が挙げられ、その意味するところは、前記 Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> で示される「置換されていてもよい環式基」における相当する意味と同様である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の単環式または縮合多環式アリール基」の意味するところは、前記 Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> で示される「置換されていてもよい環式基」における相当する意味と同様である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の複素環基」の複素環基の意味するところは、前記 Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> で示される「置換されていてもよい環式基」における相当する意味と同様である。

[0045]

上記の「置換の飽和または不飽和の脂環式炭

group, for example dimethylamino, ethyl methylamino, diethyl amino, methylpropyl amino, ethyl propyl amino, isopropyl methylamino, isopropyl ethylamino, butyl methylamino, butyl ethylamino, isobutyl methylamino, isobutyl ethylamino etc which is.

[0043]

Description above "lower alkyl carbonyl amino group" as, as for lower alkyl being same as aforementioned definition, for example methyl carbonyl amino, ethyl carbonyl amino, propyl carbonyl amino, isopropyl carbonyl amino, butyl carbonyl amino, isobutyl carbonyl amino, s-butyl carbonyl amino, t-butyl carbonyl amino, pentyl carbonyl amino, isopentyl carbonyl amino or other carbon number 2 or you can list alkyl carbonyl amino group of 7.

As substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group" as for lower alkyl being same as aforementioned definition, you can list for example methylthio, ethyl thio, propyl thio, isopropyl thio, butyl thio, isobutyl thio, neo butyl thio, t-butyl thio, pentyl thio, hexylthio or other carbon number 1 to 6 lower alkyl thio group "lower alkyl thio group" as.

[0044]

As substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group" you can list for example cycloalkyl group, cycloalkenyl group, cycloalkadienyl group etc "alicyclic hydrocarbon group of saturated or unsaturated of substituted or unsubstituted" as, that the place where it means in aforementioned Ar<sup>1</sup> and "optionally substitutable cyclic group" which is shown with Ar<sup>2</sup>, it is similar to meaning of being suitable.

Means place where "monocyclic or condensed polycyclic aryl group of substituted or unsubstituted" as substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group" in aforementioned Ar<sup>1</sup> and "optionally substitutable cyclic group" which is shown with Ar<sup>2</sup>, it is similar to meaning of being suitable.

Means place where heterocyclic group of "heterocyclic group of substituted or unsubstituted" as substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group" in aforementioned Ar<sup>1</sup> and "optionally substitutable cyclic group" which is shown with Ar<sup>2</sup>, it is similar to meaning of being suitable.

[0045]

You can list alicyclic hydrocarbon group, monocyclic or

化水素基」、「置換の単環式または縮合多環式アリール基」、「置換の複素環基」の置換基の好ましい例としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基(ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基)で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。

置換基があるとすれば、その数は1個~3個、好ましくは1個である。

置換基の位置は特に限定されない。

【0046】

上記の「低級アルキルカルボニル基」の好ましい例としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばアセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル等の炭素数2ないし6のアルカノイル基が挙げられる。

上記の「低級アルコキシカルボニル基」の好ましい例としては、その低級アルコキシは前記定義と同一であり、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル等の炭素数2ないし7のアルコキシカルボニル基が挙げられる。

それ以外の置換基の意味するところは、「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の用語として述べた通りである。

【0047】

$R^1 \sim R^6$  の定義中および「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「アシル基」とは、置換されていてもよいカルボン酸、置換されていてもよいオキシカルボン酸、置換されていてもよいスルホン酸、置換されていてもよいスルフィン酸等から由来するアシル基等が挙げら

condensed polycyclic aryl group, heterocyclic group etc of lower alkyl group, lower alkenyl group, lower alkynyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, lower alkyl carbonyl oxy group, carboxyl group, lower alkyl carbonyl group, lower alkoxy carbonyl group, carbamoyl group, lower alkyl carbamoyl group, N- di lower alkyl carbamoyl group, N- hydroxy carbamoyl group, N- hydroxy -N- lower alkyl carbamoyl group, N- phenyl carbamoyl group, N- substituted phenyl carbamoyl group, cyano group, amino group, mono lower alkyl amino group, di lower alkyl amino group, lower alkyl carbonyl amino group, amidino group, azido group, nitro group, nitroso group, mercapto group, lower alkyl thio group, sulfo group, saturated or unsaturated which is substituted with for example halogen, hydroxyl group, lower alkyl group, substituent (halogen, hydroxyl group, lower alkoxy or lower alkyl carbonyl group) as example where substituent of the above-mentioned "alicyclic hydrocarbon group of substituted saturated or unsaturated", "substituted monocyclic or condensed polycyclic aryl group", "substituted heterocyclic group" is desirable.

If we assume that there is a substituent, number 1 - 3, is preferably 1.

substitution position especially is not limited.

【0046】

As for lower alkyl being same as aforementioned definition, you can list alkanoyl group of for example acetyl, propanoyl, butyryl, isobutyryl, valeryl, isovaleryl, pivaloyl, hexanoyl or other carbon number 2-6 as example where above-mentioned "lower alkyl carbonyl group" is desirable.

As for lower alkoxy being same as aforementioned definition, the for example methoxycarbonyl, ethoxy carbonyl, propoxy carbonyl, butoxy carbonyl or other carbon number 2 or you can list alkoxy carbonyl group of 7 as example where the above-mentioned "lower alkoxy carbonyl group" is desirable.

Place where substituent other than that means is as expressed as the term of substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group".

【0047】

While defining  $R^{1 \sim 6}$  and as substituent of "optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group" "acyl group" with, you can list acyl group etc which derives from optionally substitutable carboxylic acid, optionally substitutable hydroxy carboxylic acid, optionally substitutable sulfonic acid, optionally substitutable sulfinic

れる。

具体的には、式:  $R^7CO-$ 、 $R^8OCO-$ 、 $R^9SO_2-$ 、または  $R^{10}SO-$  [式中、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  および  $R^{10}$  はそれぞれ置換されていてもよい炭化水素基または複素環基を示す] で表わされる基等が挙げられる。

#### 【0048】

上記  $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  および  $R^{10}$  で示される「置換されていてもよい炭化水素基または複素環基」における「炭化水素基」としては、例えば、非環式基としては直鎖状または分枝状の脂肪族炭化水素基(アルキル基、アルケニル基、アルキニル基等)等が挙げられ、環式基としては飽和または不飽和の脂環式炭化水素基(シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカジエニル基等)、単環式または縮合多環式アリール基等が挙げられる。

これらの意味するところと置換基の具体例は、前述した通りである。

$G^1$  中の  $R^1 \sim R^6$  で示される「置換されていてもよいアミノ基」の置換基としては、例えばヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基(ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基)で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。

それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

#### 【0049】

$G^1$  中の  $R^1 \sim R^6$  で示される「置換されていてもよいスルホ基」の置換基としては、例えばヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基(ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基)で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカ

acid etc.

Concretely, you can list group etc which is displayed with the type:  $R^{<sup>7</sup>}CO-$ ,  $R^{<sup>8</sup>}OCO-$ ,  $R^{<sup>9</sup>}SO^{<sub>2</sub>}-$ , or  $R^{<sup>10</sup>}SO-$  [In Formula,  $R^{<sup>7</sup>}$ ,  $R^{<sup>8</sup>}$ ,  $R^{<sup>9</sup>}$  and  $R^{<sup>10</sup>}$  show respective optionally substitutable hydrocarbon group or heterocyclic group ].

#### 【0048】

In above-mentioned  $R^{<sup>7</sup>}$ ,  $R^{<sup>8</sup>}$ ,  $R^{<sup>9</sup>}$  and "optionally substitutable hydrocarbon group or heterocyclic group " which is shown with  $R^{<sup>10</sup>}$ , you can list aliphatic hydrocarbon group (alkyl group, alkenyl group, alkynyl group etc) etc of straight chain or branched "hydrocarbon group " as, as for example acyclic basis the alicyclic hydrocarbon group of saturated or unsaturated (cycloalkyl group, cycloalkenyl group, cycloalkadienyl group etc), you can list monocyclic or condensed polycyclic aryl group etc as the cyclic group .

At point where these mean and embodiment of substituent is, as mentioned earlier.

You can list alicyclic hydrocarbon group, monocyclic or condensed polycyclic aryl group, heterocyclic group etc of lower alkyl group, lower alkenyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, lower alkyl carbonyl oxy group, carboxyl group, lower alkyl carbonyl group, lower alkoxy carbonyl group, carbamoyl group, lower alkyl carbamoyl group, N- di lower alkyl carbamoyl group, N- hydroxy carbamoyl group, N- hydroxy -N- lower alkyl carbamoyl group, N- phenyl carbamoyl group, N- substituted phenyl carbamoyl group, saturated or unsaturated which is substituted with for example hydroxyl group, lower alkyl group, substituent (halogen, hydroxyl group, lower alkoxy or lower alkyl carbonyl group ) as substituent of "optionally substitutable amino group " which is shown with  $R^{<sup>1</sup>}$ ~ $R^{<sup>6</sup>}$  in  $G^{<sup>1</sup>}$ .

Place where respective substituent means is, as mentioned earlier.

#### 【0049】

You can list alicyclic hydrocarbon group, monocyclic or condensed polycyclic aryl group, heterocyclic group etc of lower alkyl group, lower alkenyl group, lower alkynyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, lower alkyl carbonyl oxy group, carboxyl group, lower alkyl carbonyl group, lower alkoxy carbonyl group, carbamoyl group, lower alkyl carbamoyl group, N- di lower alkyl carbamoyl group, N- hydroxy carbamoyl group, N- hydroxy -N- lower alkyl carbamoyl group, N- phenyl carbamoyl

ルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、ニトロ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。

それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

G<sup>1</sup> 中の R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> で示される「置換されていてもよいアリール基」のアリール基の意味するところは、前述した通りである。

G<sup>1</sup> 中の R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> で示される「置換されていてもよいアリール基」の置換基としては、前記「置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」、「置換の単環式または縮合多環式アリール基」、「置換の複素環基」の置換基と同様なものが挙げられる。

それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

#### 【0050】

G<sup>1</sup> 中の R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> または R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> が一緒になって形成される「置換されていてもよいメチレン基」の置換基としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、置換または非置換のカルバモイル基、シアノ基、置換または非置換のアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、アシル基等が挙げられる。

それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

G<sup>1</sup> 中の R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> または R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> が一緒になって形成される「置換されていてもよいイミノ基」の置換基としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、置換または非置換のカルバモイル基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、アシル基等が挙げられる。

それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

group, N- substituted phenyl carbamoyl group, cyano group, amino group, mono lower alkyl amino group, di lower alkyl amino group, lower alkyl carbonyl amino group, nitro group, saturated or unsaturated which is substituted with for example hydroxyl group, lower alkyl group, substituent (halogen, hydroxyl group, lower alkoxy or lower alkyl carbonyl group) as substituent of "optionally substitutable sulfo group" which is shown with R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup>.

Place where respective substituent means is, as mentioned earlier.

Place where aryl group of "optionally substitutable aryl group" which is shown with R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> means is, as mentioned earlier.

Description above "alicyclic hydrocarbon group of substituted saturated or unsaturated", "substituted monocyclic or condensed polycyclic aryl group", you can list those which are similar to the substituent of "substituted heterocyclic group" as substituent of "optionally substitutable aryl group" which is shown with R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup>.

Place where respective substituent means is, as mentioned earlier.

#### 【0050】

R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> becoming simultaneous, you can list amino group, amidino group, azido group, nitro group, nitroso group, mercapto group, lower alkyl thio group, sulfo group, acyl group etc of the carbamoyl group, cyano group, substituted or unsubstituted of for example halogen, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, lower alkyl carbonyl oxy group, carboxyl group, substituted or unsubstituted as substituent of "optionally substitutable methylene group" which is formed.

Place where respective substituent means is, as mentioned earlier.

R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> becoming simultaneous, you can list carbamoyl group, mercapto group, lower alkyl thio group, sulfo group, acyl group etc of the for example halogen, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, lower alkyl carbonyl oxy group, carboxyl group, substituted or unsubstituted as substituent of "optionally substitutable imino group" which is formed.

Place where respective substituent means is, as mentioned

た通りである。

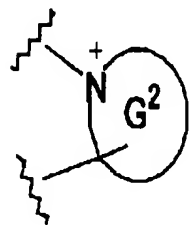
$G^1$  中の  $R^1 \sim R^6$  は、好ましくはそれぞれ同一または異なって水素原子または低級アルキル基である。

$G^1$  は好ましくは、 $-O-$  または  $-O-CR^1R^2-$  である。

【0051】

式:

【化 15】



で示される、「置換されていてもよいアザ環式基 (以下、該基を「 $G^2$ 」と便宜的に略す)」は単環または縮合環のいずれであってもよい。

例えば、以下の環式基が挙げられる。

なお、以下の式中、ホウ素と結合している環内窒素原子にプラスを付していないものであっても、その窒素原子は水素または置換されていてもよい脂肪族炭化水素基(好ましくは、低級アルキル基(例、メチル等))で置換されてプラスイオンを帯びているものとする。

【0052】

【化 16】

earlier.

$R^{1 \sim 6}$  in  $G^1$  preferably is identical or different hydrogen atom or lower alkyl group respectively.

$G^1$  is preferably,  $-O-$  or  $-O-CR^1R^2-$ .

【0051】

Formula:

[Chemical Formula 15]

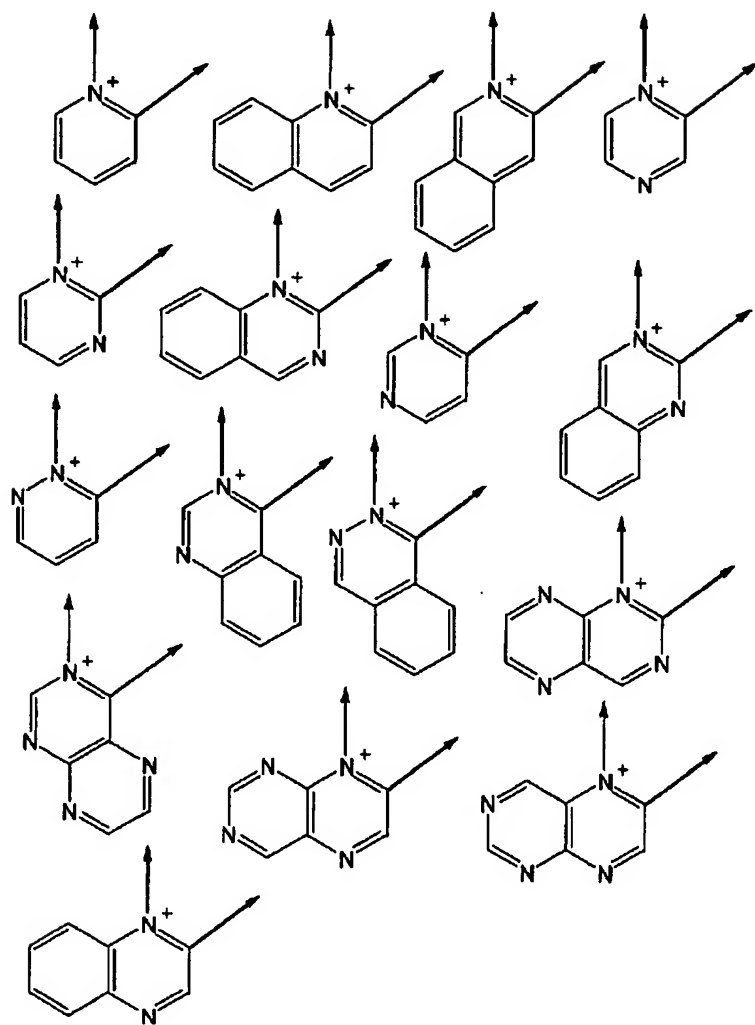
So it is shown, "optionally substitutable aza cyclic group (Below, said group is abbreviated " $G^2$ " with convention . )" is good with whichever of monocycle or the fused ring .

You can list cyclic group below for example .

Being substituted with preferably , lower alkyl group (Example and methyl etc), have plus ion . Furthermore, in Formula below, being something which plus hasnot attached on endocyclic nitrogen atom which has been connected with boron , asfor nitrogen atom hydrogen or optionally substitutable aliphatic hydrocarbon group

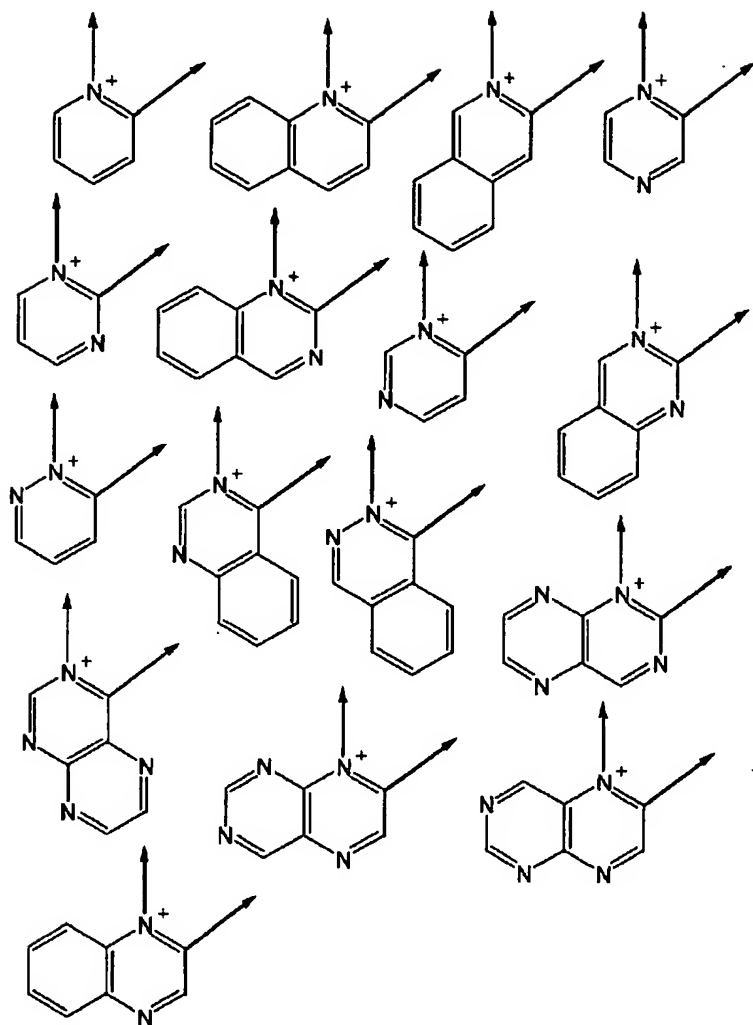
【0052】

[Chemical Formula 16]



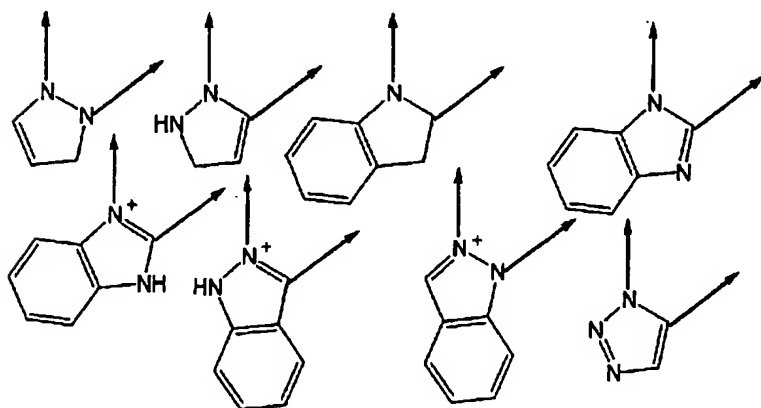
【化 17】

[Chemical Formula 17]



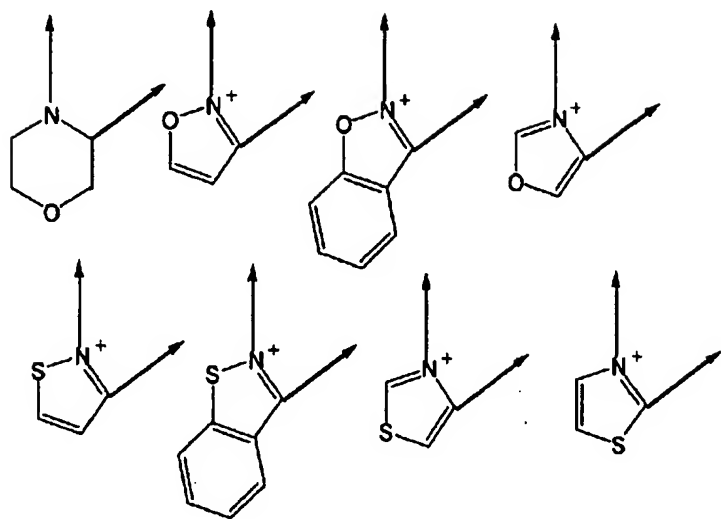
【化 18】

[Chemical Formula 18]



【化 19】

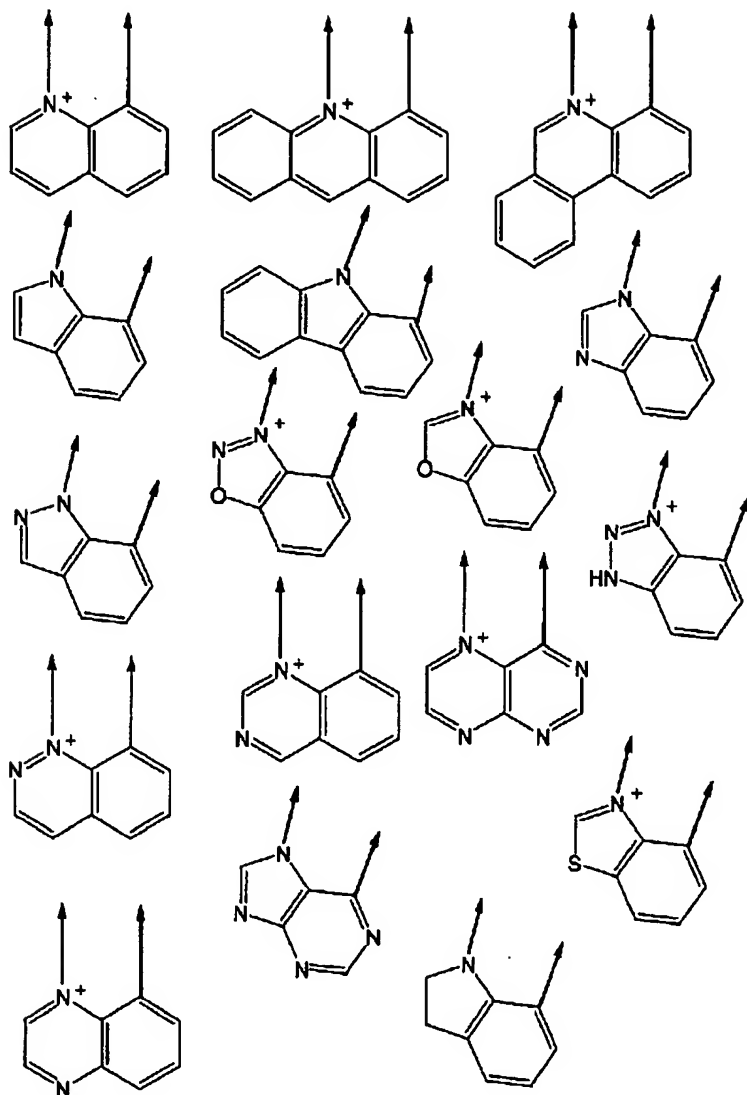
[Chemical Formula 19]



【化 20】

[Chemical Formula 20]





【0053】

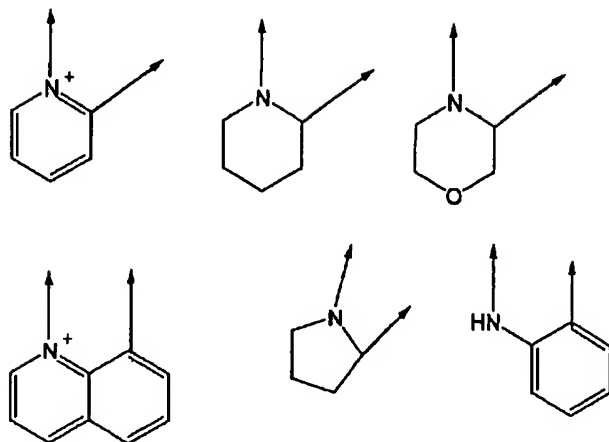
上記環式基のさらに好ましい例としては、以下の環式基が挙げられる。

【化 21】

[0053]

Above-mentioned cyclic group furthermore as desirable example, you can list cyclic group below.

[Chemical Formula 21]



【0054】

一般式(I)の定義中、「ただし、B<sup>1</sup>、G<sup>1</sup> および G<sup>2</sup> から構成される環のうち最小環は 5 員環または 6 員環であるものとする」とは式(I)中、B<sup>1</sup>、鎖式基である G<sup>1</sup> および基:G<sup>2</sup> 中におけるホウ素と結合している窒素原子を含む環のうち最小の員数の環が 5 員または 6 員であることを意味している。

一般式(I)中、Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> が同一であり、ともに置換されていてもよいアリール基である化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する植物用殺線虫剤が好ましく、より好ましくは一般式(I)中、Ar<sup>1</sup> および Ar<sup>2</sup> がともに置換されていてもよいアリール基であり、G<sup>1</sup> が式: -O-、-O-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- または -O-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>- で表される基(式中、R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキルオキシ基、置換されていてもよい低級アルケニルオキシ基)である化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する植物用殺線虫剤である。

【0055】

式(II)中、Ar<sup>1</sup> で示される置換されていてもよいアリール基は前記の定義と同義である。

Ar<sup>2</sup> で示される置換されていてもよい縮合アリール基としては、インデニル(1-インデニル、2-イ

【0054】

While defining General Formula (I), "However, from B<sup>1</sup>, G<sup>1</sup> and G<sup>2</sup> inside minimum ring of the ring which configuration is done 5 -member ring or 6-member ring is does " with in Formula (I), ring of the inside minimum number of members of ring which includes nitrogen atom which has been connected with boron in in G<sup>1</sup> and basic:G<sup>2</sup> which area B<sup>1</sup>, linear basis 5 -member or 6 -member has meant fact that is.

In General Formula (I), Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> being same, compound or its salt which is a optionally substitutable aryl group together or nematicide for plant which contains those solvent affinitive substance to be desirable, in more preferably General Formula (I), Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> being optionally substitutable aryl group together, G<sup>1</sup> formula: compound or its salt which is a group (In Formula, as for R<sup>1</sup>~R<sup>6</sup> respective identical or different hydrogen atom, halogen atom, hydroxyl group, optionally substitutable lower alkyl group, optionally substitutable lower alkenyl group, optionally substitutable lower alkyloxy group, optionally substitutable lower alkenyl oxy group) which is displayed with -O-, -O-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- or -O-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>- or it is a nematicide for plant which contains those solvent affinitive substance.

【0055】

In Formula (II), optionally substitutable aryl group which is shown with Ar<sup>1</sup> definition description above and is synonymous.

indenyl (1 -indenyl, 2- indenyl, 3- indenyl, 4- indenyl, 5-indenyl, 6-indenyl, 7-indenyl), naphthyl (1 -naphthyl, 2-

ンデニル、3-インデニル、4-インデニル、5-インデニル、6-インデニル、7-インデニル)、ナフチル(1-ナフチル、2-ナフチル等)、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル、フルオレニル(9-フルオレニル、1-フルオレニル等)等が挙げられる。

置換されていてもよい縮合アリール基の置換基の具体例としては、例えばハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基(ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基または低級アルキルカルボニル基)で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルカルボニルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。

置換基があるとすれば、その数は1個~3個、好ましくは1個である。

置換基の位置は特に限定されない。

上記のうち、より好ましい置換基としては、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である。

さらに好ましくは、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である。

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> 中の各定義は前記の定義に従う。

【0056】

式(II)で示される化合物中、好ましくは、一般式(IIa):

【化 22】

naphthyl etc), you can list anthryl, phenanthryl, acenaphthylene, fluorenyl (9-fluorenyl, 1-fluorenyl etc) etc as optionally substitutable condensed aryl group which is shown with Ar<sup>a2</sup>.

As embodiment of substituent of optionally substitutable condensed aryl group, you can list alicyclic hydrocarbon group, monocyclic or the condensed polycyclic aryl group, heterocyclic group etc of lower alkyl group, lower alkenyl group, lower alkynyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, lower alkyl carbonyl oxy group, carboxyl group, lower alkyl carbonyl group, lower alkoxy carbonyl group, carbamoyl group, lower alkyl carbamoyl group, N-di lower alkyl carbamoyl group, N-hydroxy carbamoyl group, N-hydroxy -N- lower alkyl carbamoyl group, N-phenyl carbamoyl group, N-substituted phenyl carbamoyl group, cyano group, amino group, mono lower alkyl amino group, di lower alkyl amino group, lower alkyl carbonyl amino group, amidino group, azido group, nitro group, nitroso group, mercapto group, lower alkyl thio group, sulfo group, saturated or unsaturated which is substituted with for example halogen atom, hydroxyl group, lower alkyl group, substituent (halogen, hydroxyl group, lower alkoxy group or lower alkyl carbonyl group).

If we assume that there is a substituent, number 1 - 3, is preferably 1.

substitution position especially is not limited.

Among descriptions above, as a more desirable substituent, it is a halogen atom, methyl, trihalomethyl, hydroxyl group, methoxy, amino group or a sulfo group.

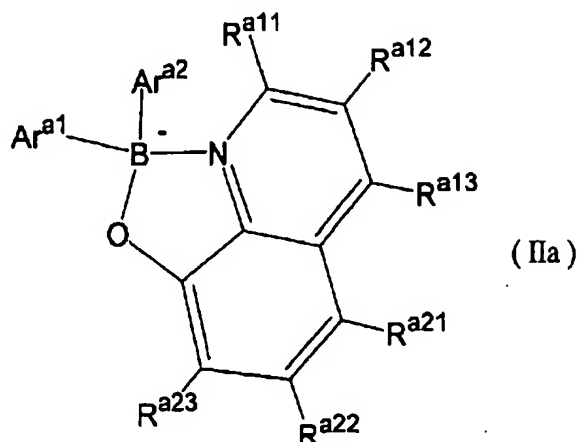
Furthermore it is a preferably, fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxyl group, methoxy or a sulfo group.

As for each definition in R<sup>a1</sup> and R<sup>a2</sup> you follow the definition description above.

【0056】

In compound which is shown with Formula (II), preferably, General Formula (IIa):

[Chemical Formula 22]



[式中、 $Ar^{a1}$  および  $Ar^{a2}$  はともに置換されていてもよいアリールであり、 $R^{a11} \sim R^{a13}$  および  $R^{a21} \sim R^{a23}$  はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]で示される化合物である。

より好ましくは、 $R^{a11} \sim R^{a13}$  および  $R^{a21} \sim R^{a23}$  がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。

さらに好ましくは、 $R^{a11}$ 、 $R^{a21}$ 、 $R^{a23}$  がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メキシまたはスルホ基である化合物である。

【0057】

式(III)中、 $Ar^{b1}$ 、 $Ar^{b2}$ 、 $R^{b1}$ 、 $R^{b2}$ 、 $R^{b3}$  における各定義は前記の定義に従う。

式(III)で示される化合物中、好ましくは、一般式(IIIa):

【化 23】

It is a compound which is shown with [In Formula, as for  $Ar^{a1}$  and  $Ar^{a2}$  together with optionally substitutable aryl, as for  $R^{a11} \sim R^{a13}$  and  $R^{a21} \sim R^{a23}$  becoming independent respectively, the identical or different hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, lower haloalkyl group, hydroxyl group, optionally substitutable amino group or optionally substitutable sulfo group it shows ].

more preferably,  $R^{a11} \sim R^{a13}$  and  $R^{a21} \sim R^{a23}$  becoming independent respectively, it is a compound which is a identical or different hydrogen atom, halogen atom, methyl, trihalomethyl, hydroxyl group, methoxy, amino group or a sulfo group.

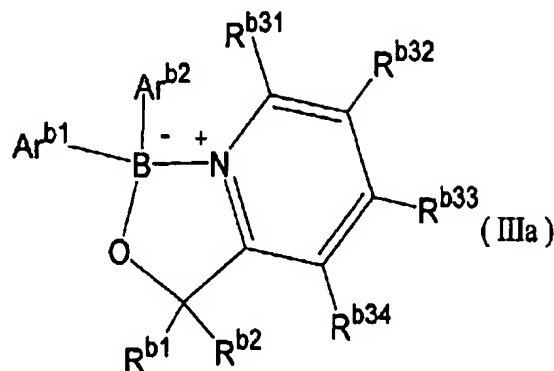
Furthermore preferably,  $R^{a11}$ ,  $R^{a21}$ ,  $R^{a23}$  becoming independent respectively, it is a compound which is a identical or different fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxyl group, methoxy or a sulfo group.

【0057】

In Formula (III), as for each definition in  $Ar^{b1}$ ,  $Ar^{b2}$ ,  $R^{b1}$ ,  $R^{b2}$ ,  $R^{b3}$  you follow the definition description above.

In compound which is shown with Formula (III), preferably, General Formula (IIIa):

[Chemical Formula 23]



[式中、Ar<sup>b1</sup> および Ar<sup>b2</sup> はともに置換されていてもよいアリールであり、R<sup>b1</sup> および R<sup>b2</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R<sup>b1</sup> と R<sup>b2</sup> が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する; R<sup>b31</sup>~R<sup>b34</sup> はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]で示される化合物である。

より好ましくは、R<sup>b31</sup>~R<sup>b34</sup> がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。

さらに好ましくは、R<sup>b32</sup>、R<sup>b33</sup>、R<sup>b34</sup> がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

[0058]

式(IV)中、Ar<sup>c1</sup>、Ar<sup>c2</sup>、R<sup>c1</sup>、R<sup>c2</sup>、R<sup>c3</sup>における各定義は前記の定義に従う。

式(IV)で示される化合物中、好ましくは Ar<sup>c1</sup> および Ar<sup>c2</sup> が置換されていてもよいアリールであり、

It is a compound which is shown with [In Formula, as for Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> together with optionally substitutable aryl, as for R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> becoming independent respectively, it is a hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, halogenated lower alkyl group, halogenation lower alkenyl group, optionally substitutable aralkyl group, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, halogenation lower alkoxy group, halogenation lower alkenyl oxy group, acyloxy, optionally substitutable phenyl oxy, optionally substitutable aralkyloxy, optionally substitutable amino group, optionally substitutable sulfo group, or a optionally substitutable aryl group, or or R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> becomes simultaneous and forms oxo, optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino ; R<sup>b31</sup>~R<sup>b34</sup> shows becoming independent respectively, identical or different hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, lower haloalkyl group, hydroxyl group, optionally substitutable amino group or optionally substitutable sulfo group ].

more preferably, R<sup>b31</sup>~R<sup>b34</sup> becoming independent respectively, it is a compound which is a identical or different hydrogen atom, halogen atom, methyl, trihalomethyl, hydroxyl group, methoxy, amino group or a sulfo group .

Furthermore preferably, R<sup>b32</sup>, R<sup>b33</sup>, R<sup>b34</sup> becoming independent respectively, it is a compound which is a identical or different fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxyl group, methoxy or a sulfo group .

[0058]

In Formula (IV), as for each definition in Ar<sup>c1</sup>, Ar<sup>c2</sup>, R<sup>c1</sup>, R<sup>c2</sup>, R<sup>c3</sup> you follow the definition description above.

In compound which is shown with Formula (IV), preferably Ar<sup>c1</sup> and Ar<sup>c2</sup> being optionally

R<sup>c3</sup> がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す化合物である。

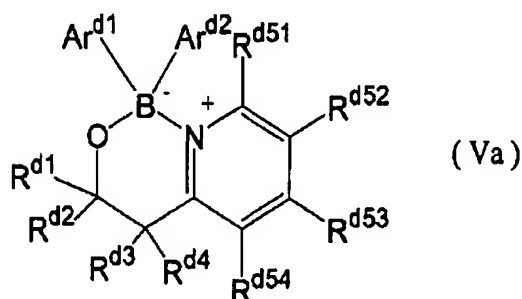
さらに好ましくは、R<sup>c3</sup> がそれぞれ独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

【0059】

式(V)中、Ar<sup>d1</sup>、Ar<sup>d2</sup>、R<sup>d1</sup>、R<sup>d2</sup>、R<sup>d3</sup>、R<sup>d4</sup>、R<sup>d5</sup>における各定義は前記の定義に従う。

式(V)で示される化合物中、好ましくは一般式(Va):

【化 24】



[式中、Ar<sup>d1</sup> および Ar<sup>d2</sup> は置換されていてもよいアリールであり、R<sup>d1</sup>、R<sup>d2</sup>、R<sup>d3</sup> および R<sup>d4</sup> はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R<sup>d1</sup> と R<sup>d2</sup> および/または R<sup>d3</sup> と R<sup>d4</sup> が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する、R<sup>d51</sup>~R<sup>d54</sup> はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]で

substitutable aryl, R<sup>c3</sup> becoming independent respectively, it is a compound which shows hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, lower haloalkyl group, hydroxyl group, optionally substitutable amino group or optionally substitutable sulfo group.

Furthermore preferably, R<sup>c3</sup> becoming independent respectively, it is a compound which is a fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxyl group, methoxy or a sulfo group.

【0059】

In Formula (V), as for each definition in Ar<sup>d1</sup>, Ar<sup>d2</sup>, R<sup>d1</sup>, R<sup>d2</sup>, R<sup>d3</sup>, R<sup>d4</sup>, R<sup>d5</sup> you follow the definition description above.

In compound which is shown with Formula (V), preferably General Formula (Va):

[Chemical Formula 24]

It is a compound which is shown with [In Formula, as for Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> with optionally substitutable aryl, as for R<sup>d1</sup>, R<sup>d2</sup>, R<sup>d3</sup> and R<sup>d4</sup> becoming independent respectively, it is a hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, halogenated lower alkyl group, halogenation lower alkenyl group, optionally substitutable aralkyl group, hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkenyl oxy group, halogenation lower alkoxy group, halogenation lower alkenyl oxy group, acyloxy, optionally substitutable phenyl oxy, optionally substitutable aralkyloxy, optionally substitutable amino group, optionally substitutable sulfo group, or a optionally substitutable aryl group, or or R<sup>d1</sup> and R<sup>d2</sup> and/or R<sup>d3</sup> and R<sup>d4</sup> becomes simultaneous and forms oxo, optionally substitutable methylene or optionally substitutable imino, R<sup>d51</sup>~R<sup>d54</sup> shows becoming independent respectively, identical or different hydrogen atom, halogen atom, lower alkyl group, lower alkenyl group, lower haloalkyl group, hydroxyl

示される化合物である。

より好ましくは、 $R^{d51}$ ~ $R^{d54}$  がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。

さらに好ましくは、 $R^{d52}$ 、 $R^{d53}$ 、 $R^{d54}$  がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

【0060】

本発明は上記化合物の製薬的に許容される塩およびその溶媒和物も包含する。

本発明の目的化合物の「塩」としては、製薬的に許容される塩が好ましく、例えば無機塩基との塩、有機塩基との塩、無機酸との塩、有機酸との塩、塩基性または酸性アミノ酸塩などが挙げられる。

無機塩基との塩としては、ナトリウム塩、カリウム塩などのアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、バリウム塩などのアルカリ土類金属塩、ならびにアルミニウム塩、アンモニウム塩などが挙げられる。

有機塩基との塩としては、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジン、ピコリン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、ジシクロヘキシルアミン、 $N,N'$ -ジベンジルエチレンジアミンなどとの塩が挙げられる。

無機酸との塩としては、塩酸、フッ化水素酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸、過塩素酸、ヨウ化水素酸などとの塩が挙げられる。

有機酸との塩としては、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、シュウ酸、酒石酸、マレイン酸、クエン酸、コハク酸、リンゴ酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸などとの塩が挙げられる。

塩基性アミノ酸との塩としては、アルギニン、リジン、オルニチンなどとの塩が挙げられ、酸性アミノ酸との塩としては、アスパラギン酸、グルタミン酸などとの塩が挙げられる。

本発明の目的化合物およびその塩の「溶媒和物」は有機溶媒および/または水との溶媒和物を

group, optionally substitutable amino group or optionally substitutable sulfo group ].

more preferably,  $R^{d51}$ ~ $R^{d54}$  becoming independent respectively, it is a compound which is a identical or different hydrogen atom, halogen atom, methyl, trihalomethyl, hydroxyl group, methoxy, amino group or a sulfo group.

Furthermore preferably,  $R^{d52}$ ,  $R^{d53}$ ,  $R^{d54}$  becoming independent respectively, it is a compound which is a identical or different fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxyl group, methoxy or a sulfo group.

[0060]

this invention includes medicine manufacture also acceptable salt and its solvent affinitive substance of above-mentioned compound.

TRANSLATION STALLEDthis invention target compound acceptable salt for example inorganic base salt, organic base salt, inorganic acid salt, organic acid salt, basic acidic amino acid salt salt

As salt of inorganic base, you can list sodium salt, potassium salt or other alkali metal salt, calcium salt, magnesium salt, barium salt or other alkaline earth metal salt, and aluminum salt, ammonium salt etc.

As salt of organic base, you can list salt of trimethyl amine, triethylamine, pyridine, picoline, ethanolamine, diethanolamine, triethanolamine, dicyclohexyl amine,  $N,N'$ -dibenzyl ethylenediamine etc.

As salt of inorganic acid, you can list salt of hydrochloric acid, hydrofluoric acid, hydrobromic acid, nitric acid, sulfuric acid, phosphoric acid, perchloric acid, hydroiodic acid etc.

As salt of organic acid, you can list salt of formic acid, acetic acid, trifluoroacetic acid, fumaric acid, oxalic acid, tartaric acid, maleic acid, citric acid, succinic acid, malic acid, mandelic acid, ascorbic acid, lactic acid, gluconic acid, methane sulfonic acid, p-toluenesulfonic acid, benzenesulfonic acid etc.

As salt of basic amino acid, you can list salt of arginine, lysine, ornithine, etc you can list salt of aspartic acid, glutamic acid etc as salt of acidic amino acid.

target compound of this invention and "solvent affinitive substance" of its salt include solvent affinitive substance of

包含する。

水和物が好ましく、具体的には一水和物、二水和物、六水和物等が挙げられる。

【0061】

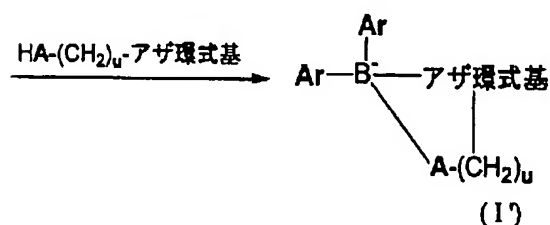
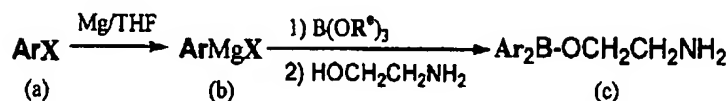
#### 【発明の実施の形態】

本発明組成物の有効成分である化合物(I)[すなわち、一般式(I)で表される化合物。以下、他の式で表される化合物についても同様に略記することがある。]は、公知の文献(例、Youji Huaxue (1989),9(3), 226-9, Pharmazie (1985), 40(11), 767-71、Pharmazie (1985), 40(6), 387-93、Pharmazie (1985), 40(5), 307-11、J.Chem.Soc.Perkin Train. 2 (1992) 527-532、Journal of Organometallic Chemistry, 297(1985)13-19)を参考にして、例えば以下に示す合成ルートによって製造することができる。

なお、これらのルートにおいて置換基の種類( $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  および  $R^4$ )によっては以下の反応において反応性を有することがある(例、ヒドロキシ基、カルボニル基およびアミノ基等)が、その場合は適宜置換基に保護基を導入し反応後除去することにより製造を行えばよい。

(反応式)

【化 25】



[式中、 $u$  は 0、1 または 2 の整数、 $R^e$  は炭素数 1~8 のアルキル基を示し、他の記号は前記と同意義である]

【0062】

#### 工程 1

まず、化合物(a)とマグネシウムをテトラヒドロフラン(THF)などのエーテル溶媒中で反応させる

organic solvent and/or water.

hydrate is desirable, can list monohydrate, dihydrate, hexahydrate etc concretely.

【0061】

#### 【Embodiment of the Invention】

It can produce compound (I) [There are times when you briefly describe in same way below the compound, which is displayed with namely, General Formula (I), concerning compound which is displayed with other system.] which is a active ingredient of this invention composition, with the synthesis route which is shown below for example with literature (Example and Youji Huaxue (1989), 9 (3), 226 - 9, Pharmazie (1985), 40 (11), 767 - 71, Pharmazie (1985), 40 (6), 387 - 93, Pharmazie (1985), 40 (5), 307 - 11, Journal of the Chemical Society (JCSIA) Perkin Train. 2 (1992) 527-532, Journal of Organometallic Chemistry (0022 - 328 X, JORCA), 297 (1985) 13 - 19) of public knowledge asreference.

Furthermore, in these root with types ( $R^{>1}$ ,  $R^{>2}$ ,  $R^{>3}$  and  $R^{>4}$ ) of substituent (Example, hydroxyl group, carbonyl group and amino group etc) which is times when it possesses reactivity at time of reacting below, in that case it introduces protecting group into as needed substituent and after reacting it should have produced by removing.

(reaction scheme)

【Chemical Formula 25】

[In Formula, as for  $u$  0, 1 or 2 as for integer,  $R^{>e}$  it shows the alkyl group of carbon number 1~8, other symbol being same meaning asdescription above, it is ]

【0062】

#### step 1

First, compound (a) with compound which is shown magnesium with thetype:ArMgX (b) by reacting in



ことにより、式:ArMgX(b)で示される化合物を製造する。

本反応において、化合物(a)は、マグネシウムに対して 1 当量またはそれ以上、好ましくは 1.1~1.3 当量使用することができる。

使用できるエーテル系溶媒としてはテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサンなどが挙げられる。

さらに必要なら芳香族炭化水素類(例、トルエン、ベンゼン、キシレンなど)、または飽和炭化水素類(例、シクロヘキサン、ヘキサンなど)をエーテル系溶媒との混合溶媒として使用することができる。

反応温度は-20~150 deg C、好ましくは 0~50 deg C である。

反応時間は化合物により異なるが 0.5~10 時間反応させればよい。

反応生成物は通常透明溶液またはスラリーとして得られる。

【0063】

## 工程 2

上記得られた化合物(b)を含む溶液またはスラリーにホウ酸化合物(B(OR)<sup>3</sup>)を反応させた後、さらにエタノールアミン(HOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>)を適当な溶媒中で反応させることにより式(c)で示される化合物を製造する。

本反応において、上記工程 1 で得られた化合物(b)に対してホウ酸エステルは 0.5 当量またはそれ以下、好ましくは 0.5~0.4 当量使用することができる。

逐次反応のエタノールアミンは化合物(b)に対して 0.5 当量またはそれ以上、好ましくは 0.5~0.7 当量使用することができる。

本反応においては必要なら工程 1 に記載したエーテル類、芳香族炭化水素類、飽和炭化水素類の溶媒を使用することができる。

化合物(b)とホウ酸エステルとの反応温度は-90~100 deg C、好ましくは-30~40 deg C、反応時間は化合物により異なるが 0.5~10 時間反応させればよい。

また、逐次反応のエタノールアミンとの反応温度は 0~100 deg C、好ましくは 30~80 deg C、反応時間は通常 0.5~5 時間反応させればよい。

tetrahydrofuran (THF) or other ether solvent, is produced.

In this reaction, 1 equivalent or above that, preferably 1.1~1.3 equivalent you can use compound (a), vis-a-vis magnesium.

You can list tetrahydrofuran, diethyl ether, dioxane etc as ether solvent which you can use.

Furthermore if necessity aromatic hydrocarbons (Such as example and toluene, benzene, xylene), or you can use saturated hydrocarbon (Such as example and cyclohexane, hexane) as mixed solvent of ether solvent.

reaction temperature - is 20 - 150 deg C, preferably 0~50 deg C.

If reaction time differs depending upon compound but 0.5 - 10 hours it should have reacted.

reaction product is acquired usually as transparent solution or slurry.

[0063]

## step 2

Description above boric acid compound (B(OR)<sup>3</sup>) after reacting, furthermore compound which is shown ethanolamine (HOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>) with Formula (c) by reacting in suitable solvent is produced in solution or slurry which includes compound (b) which is acquired.

0.5 equivalent or less than that, preferably 0.5~0.4 equivalent you can use boric acid ester in this reaction, vis-a-vis compound (b) which is acquired with above-mentioned step 1.

0.5 equivalent or above that, preferably 0.5~0.7 equivalent you can use ethanolamine of gradual reaction vis-a-vis compound (b).

Regarding this reaction if necessity solvent of ethers, aromatic hydrocarbons, saturated hydrocarbon which are stated in step 1 can be used.

If compound (b) with as for reaction temperature of boric acid ester - as for 90 - 100 deg C, preferably -30~40 deg C, reaction time it differs depending upon compound but 0.5 - 10 hours it should have reacted.

In addition, if as for reaction temperature of ethanolamine of gradual reaction as for 0 - 100 deg C, preferably 30~80 deg C, reaction time usually 0.5 - 5 hours it should have reacted.

化合物(c)は粗製物として、あるいは常法(例、カラムクロマトグラフィー、再結晶など)により精製して次工程に使用することができる。

【0064】

工程 3

化合物(c)に式:HA-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アザ環式基

で表される化合物を適当な溶媒中で反応させることにより、式(I')で示される本発明化合物を製造することができる。

HA-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アザ環式基で表される化合物は化合物(c)に対して1~2当量、好ましくは1~1.5当量使用することができる。

使用できる溶媒としては、エーテル類(例、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなど)、炭化水素類(例、ベンゼン、トルエン、キシレンなど)、アルコール類(例、メタノール、エタノール、n-プロパノールなど)、水およびそれらの混合溶媒などが挙げられる。

反応温度は 0~150 deg C、好ましくは 20~120 deg C であり、反応時間は通常、0.5~10 時間である。

得られた所望の化合物(I')は要すれば、例えばカラムクロマトグラフィー、再結晶などにより精製することができる。

より詳細な製造操作は、WO00/44387 に記載されている。

【0065】

本発明の殺線虫剤は、少なくとも一般式(I)等で表される化合物等を、0.1~95 重量%、好ましくは2~80 重量%含む。

これらの殺線虫剤は、単独でまたは希釈して使用することができる。

使用方法および使用濃度は、使用する化合物、使用目的、対象植物、使用期間および土壌の種類等によって異なるが、一般には次の通りである。

例えば、粒状の製剤は 10a(アール)当たり 10~50kg を表面から深さ約 20cm までの土壌に全面混和する。

本発明殺線虫剤は、10a 当たり 10g~100kg、好ましくは 100g~20kg 使用される。

処理面積が広い場合には、トラクタを用いて混和する、あるいは灌漑水に混ぜて土壌中に浸

Refining as crude product , or with conventional method (Such as example and column chromatography , recrystallization ), you can use for next step compound (c ).

【0064】

step 3

In compound (c ) type:HA- (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-aza cyclic group

So the compound of this invention which is shown compound which is displayed with the Formula (I') by reacting in suitable solvent , can be produced.

1 - 2 equivalent , preferably 1~1.5equivalent you can use compound which is displayed with HA- (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-aza cyclic group vis-a-vis compound (c ).

ethers (Such as example and diethyl ether , tetrahydrofuran , dioxane ), hydrocarbons (Such as example and benzene , toluene , xylene ), alcohols (Such as example and methanol , ethanol , n- propanol ), you can list water and those mixed solvent etc as solvent which you can use.

As for reaction temperature with 0 - 150 deg C, preferably 20~120 deg C, as for reaction time usually, they are 0.5 - 10 hours .

If it requires desired compound (I\* ) which it acquires, it can refine with the for example column chromatography , recrystallization etc.

From detailed production operation is stated in WO 00/44387.

【0065】

nematicide of this invention , 0.1 - 95 weight % , preferably 2~80weight % includes compound etc which is displayed at least with General Formula (I ) etc.

Or diluting with alone , you can use these nematicide .

method of use and used concentration differ in compound , use objective , object plant , use period and types etc of the soil which are used, but as follows it is general.

formulation of for example granular per 10 a (are ) 10 - 50 kg from surface entire surface mixes to soil to depth approximately 20 cm .

this invention nematicide is used per 10 are 10g~100kg , preferably 100g~20kg .

When treated surface area is wide, it mixes making use of tractor , or mixing into irrigation water , there is a method

透させる方法がある。

一般に、上記製剤は、少なくとも一種の本発明に係る化合物(I)を、0.1~95 重量%、好ましくは、2~80 重量%含む。

これらの製剤は単独で、または希釈して使用することができる。

使用濃度は、使用する化合物、使用目的、使用時期により異なるが、一般に約 1~5,000ppm、好ましくは約 100~5,000ppm 程度の範囲で用いられる。

本発明に係る化合物(I)は、約 10g~5kg/ヘクタール、好ましくは、約 100g~1,000g/ヘクタールで使用する。

[0066]

本殺線虫剤を使用するに際しては、使用場面に応じて各種の担体と混合し、例えば、粒剤、水和剤、乳剤または懸濁剤等として使用することができる。

上記のような態様は、少なくとも1種の本発明の化合物と適当な固体または液体の担体類、および所望により有効成分の分散性や、他の性質の改善のために適当な補助剤(例えば、界面活性剤、展着剤、分散剤、安定化剤、乳化剤、懸濁剤、浸透剤、湿潤剤等)とともに混合する通常の方法によって得ることができる。

固体の担体または希釈剤の例としては、植物性物質(例えば、穀物粉、タバコ茎粉、大豆粉、クルミ殻粉、野菜粉、カンナ屑、ぬか、樹皮粉、繊維素粉、野菜抽出残渣)、繊維状物質(例えば、紙、ダンボール紙、ぼろ布)、人工の可塑性粉末、粘土(例えば、カオリン、珪藻土、ベントナイト、白土、クレー)、タルクおよび無機物質(葉ろう石、絹雲母、軽石、硫黄粉、活性炭)、化学肥料(例えば、硫酸、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素、塩化アンモニウム)などがある。

液体担体および希釈剤としては、水、アルコール類(例えば、メタノール、エタノール)、ケトン類(例えば、アセトン、メチルエチルケトン)、エーテル類(例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、テトラヒドロフラン)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、トルエン、キシレン、メチルナフタレン)、脂肪族炭化水素(例えば、ガソリン、ケロシン、灯油)、エステル類、ニトリル類、酸アミド(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド)、ハロゲン化炭化水素

which permeates in soil .

Generally, above-mentioned formulation , 0.1 - 95 weight % , preferably , 2~80weight % includes the compound ( I ) which relates to this invention of at least one kind .

Or diluting with alone , you can use these formulation .

used concentration differs depending upon compound , use objective , use time which is used , but it is used generally in range of approximately 1 - 5,000 ppm , preferably approximately 100 - 5,000 ppm extent .

You use compound ( I ) which relates to this invention , with approximately 10 g~5kg /hectare , preferably , approximately 100 g~1, 000g/hectare .

[0066]

When this nematicide is used, it can mix with various carrier according to use location , it can use as for example granule , wettable , emulsion or suspension etc.

As description above dispersivity of active ingredient and for improving the other property with suitable auxiliary agent (for example boundary surfactant , spreading agent , dispersant , stabilizer , emulsifier , suspension , permeant , humectant etc) it can acquire embodiment , with conventional method which is mixed compound of this invention of at least 1 kind and carrier of suitable solid or liquid , and with desire.

As example of support or diluent of solid , vegetable substance (for example grain decimeter , tobacco stem decimeter , soybean meal , walnut shell flour , vegetable decimeter , Canna generalis Bailey waste , rice bran , bark decimeter , cellulose decimeter , vegetable extraction residue ) , fibrous substance (for example paper , cardboard box paper , rag fabric ) , the artificial plasticity powder , clay (for example kaolin , silicon algae earth , bentonite (DANA 71.3.1a.1-2 ) , kaolin , clay ) , talc and inorganic substance (leaf pyrophyllite , sericite (DANA 71.2.2a.1 ) , pumice , sulfur decimeter , activated carbon ) , there is a chemical fertilizer (for example ammonium sulfate , ammonium phosphate , ammonium nitrate , urea , ammonium chloride ) etc.

As liquid carrier and diluent , water and alcohols (for example methanol , ethanol ) , ketones (for example acetone , methylethyl ketone ) , ethers (for example diethyl ether , dioxane , cellosolve , tetrahydrofuran ) , aromatic hydrocarbon (for example benzene , toluene , xylene , methyl naphthalene ) , aliphatic hydrocarbon (for example gasoline , kerosine , illuminating oil ) , esters , nitriles , acid amide (for example N , N- dimethylformamide , N , N- dimethylacetamide ) , halogenated hydrocarbon (for example dichloroethane , carbon tetrachloride ) , there is a solvent

(例えば、ジクロロエタン、四塩化炭素)、ソルベントナフサ、シクロヘキサンなどがある。

【0067】

補助剤としての界面活性剤の例としては、アルキル硫酸エステル、スルホン酸アルキル、スルホン酸アルキルアリール、ポリエチレングリコールエーテル、多価アルコールエステル類などがある。

展着剤または分散剤の例には、カゼイン、ゼラチン、デンプン粉、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、アルギン酸、リグニン、ベントナイト、糖蜜、ポリビニルアルコール、パイン油および寒天などが挙げられる。

安定化剤としては、PAP(イソプロピルリン酸塩混合物)、リン酸トリクレジル(TCP)、トル油、エポキシ油、界面活性剤類、脂肪酸類およびそのエステル類が挙げられる。

本発明の殺線虫剤は他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、肥料、または土壌処理剤(改良剤)等と混合して用いることができる。

【0068】

【実施例】

以下に製造例、実施例および試験例を挙げて本発明をさらに詳細に説明するが、これらは本発明の範囲の限定を意図するものでない。

参考例、製造例中、Phはフェニル基、Naphはナフチル基、Me<sub>3</sub>Si-Phはトリメチルシリルフェニル基、t-Buはtert-ブチル基、をそれぞれ意味する。

【0069】

参考例 1

ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル(Ph<sub>2</sub>B-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>)の合成

ブロモベンゼン 83.2g(0.53mol)、マグネシウム 12.9g(0.53mol)およびテトラヒドロフラン 250mlを用いて常法にてフェニルマグネシウムブロマイドのテトラヒドロフラン溶液を調製した。

次いで、フラスコにホウ酸トリブチルエステル 58.5g(0.26mol)、エチルエーテル 200 mlを仕込み、-60 deg Cに冷却維持しフェニルマグネシウムブロマイドのテトラヒドロフラン溶液(グリニャール試薬)を滴下した。

滴下終了後、室温下で10時間攪拌した後、10%

naphtha, cyclohexane etc.

【0067】

There is a alkyl sulfate ester, sulfonic acid alkyl, alkylaryl sulfonate, polyethylene glycol ether, polyhydric alcohol esters etc as example of boundary surfactant as auxiliary agent.

casein, gelatin, starch decimeter, carboxymethyl cellulose, gum arabic, alginic acid, lignin, bentonite (DANA 71.3.1a.1-2), you can list to example of spreading agent or dispersant, molasses, poly vinyl alcohol, pine oil and agar etc.

As stabilizer, PAP (isopropyl phosphate mixture), tricresyl phosphate (TCP), tall oil, epoxy oil, boundary surfactant, you can list fatty acids and its esters.

Mixing with other microbicide, insecticide, miticide, fertilizer, or soil treatment agent (modifier) etc, you can use nematocide of this invention.

【0068】

[Working Example(s)]

Listing Production Example, Working Example and Test Example below, furthermore you explain the this invention in detail, but these are not something which intends the limitation of range of this invention.

In Reference Example, Production Example, as for Ph as for phenyl group, Naph as for naphthyl group, Me<sub>3</sub>Si-Ph as for trimethylsilyl phenyl group, t-Bu t-butyl group, is meant respectively.

【0069】

Reference Example 1

Synthesis of diphenylboronic acid ethanolamine ester  
(Ph<sub>2</sub>B-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>)

tetrahydrofuran solution of phenyl magnesium bromide was manufactured with conventional method bromobenzene 83.2g (0.53 mol), making use of magnesium 12.9g (0.53 mol) and tetrahydrofuran 250ml.

Next, tributyl borate ester 58.5g (0.26 mol), you inserted ethyl ether 200 ml in flask, - in 60 deg C it cooled maintained and dripped tetrahydrofuran solution (Grignard reagent) of phenyl magnesium bromide.

hydrolysis it did 10 hours after agitating, including 10%

塩酸水溶液 150 ml を加えて加水分解し有機層を分液した。

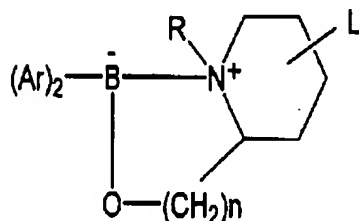
得られた有機層にエタノールアミン 31.1 g(0.51mol)、エタノール 50 ml を加えて 2 時間室温下で攪拌した。

生成した沈殿を濾集し、含水アルコールで再結晶し乾燥して白色結晶のジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル 31.9 g(収率 55%)を得た。

【0070】

以下の製造例 1~4 は下記式で示される化合物に関する：

【化 26】



製造例 1

化合物 1(式中、n が 1、Ar がフェニル、R および L が水素)の合成

ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル 2.6g(0.012mol)、エチルエーテル 30 ml および 10%塩酸水溶液 30ml をロートに仕込み、約 15 分間振り混ぜた後分液し、有機層を 1 回水洗しナスフラスコに移し替えた。

その後、2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.1g(0.018mol)とエタノール 7ml を加えて室温下で 2 時間攪拌した。

生成した沈殿を濾集し、含水アルコールで再結晶し乾燥して白色結晶の化合物 1 を 2.8g(収率 83%)得た。

融点:169~171 deg C

【0071】

製造例 2

化合物 2(式中、n が 1、Ar が 2-メチルフェニル、R および L が水素)の合成

ジ(2-メチル)-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 3.04g(0.012mol)と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g(0.018mol)を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 2 を

hydrochloric acid solution 150 ml after end of dropping addition and under room temperature separating did organic layer .

To organic layer which it acquires it agitated under 2 hours room temperature ethanolamine 31.1 g (0.51 mol ),including ethanol 50 ml .

It filtered precipitation which it forms, recrystallization did with the water-containing alcohol and dried and acquired diphenylboronic acid ethanolamine ester 31.9 g (yield 55% ) of white crystal .

[0070]

Production Example 1~4 below regards compound which is shown with below-mentioned formula:

[Chemical Formula 26]

Production Example 1

Synthesis of compound 1 (In Formula, n 1, Ar phenyl , R and L hydrogen )

diphenylboronic acid ethanolamine ester 2.6g (0.012 mol ), you inserted ethyl ether 30 ml and 10% hydrochloric acid solution 30ml in funnel ,approximately 15 min after shaking, separating you did, one time water wash did organic layer and transferred to round-bottom flask .

After that, 2 hours it agitated under room temperature 2 -hydroxymethyl piperidine 2.1g (0.018 mol ) withincluding ethanol 7ml .

It filtered precipitation which it forms, recrystallization did with the water-containing alcohol and dried and 2.8 g (yield 83% ) acquired compound 1 of white crystal .

melting point :169~171 deg C

[0071]

Production Example 2

Synthesis of compound 2 (In Formula, n 1, Ar 2 -methylphenyl , R and L hydrogen )

di (2 -methyl ) -phenylboronic acid ethanolamine ester 3.04g (0.012 mol ) with 2 -hydroxymethyl piperidine 2.10g (0.018 mol ) in same way as the synthetic method of compound 1 it reacted, treated and 2.18 g (yield 78% ) acquired the

2.18g(収率 78%)得た。

融点:126~128 deg C

#### 製造例 3

化合物 9(式中、n が 1、Ar が 3-クロロフェニル、R および L が水素)の合成

ジ-(3-クロロ)-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 3.54g (0.012mol)と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g(0.018mol)を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 9 を 3.28g(収率 78%)得た。

融点:155~159 deg C

#### 製造例 4

化合物 31(式中、n が 1、Ar が  $\alpha$ -ナフチル、R および L が水素)の合成

ジ- $\alpha$ -ナフチルボロン酸エタノールアミンエステル 3.90g(0.012mol)と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g(0.018mol)を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 31 を 3.01g(収率 79%)得た。

融点:176~178 deg C

上記製造例 1~4 を参考にすれば、以下の表 1~12 中に示される化合物を製造することができる。

[0072]

[表 1]

compound 2 of white crystal .

melting point :126~128 deg C

#### Production Example 3

Synthesis of compound 9 (In Formula, n 1, Ar 3-chlorophenyl , R and L hydrogen )

di- (3 -chloro ) -phenylboronic acid ethanolamine ester 3.54g (0.012 mol ) with 2 -hydroxymethyl piperidine 2.10g (0.018 mol ) in same way as the synthetic method of compound 1 it reacted, treated and 3.28 g (yield 78% ) acquired the compound 9 of white crystal .

melting point :155~159 deg C

#### Production Example 4

Synthesis of compound 31 (In Formula, n 1, Ar;  $\alpha$ -naphthyl , R and L hydrogen )

di-  $\alpha$ -naphthyl boronic acid ethanolamine ester 3.90g (0.012 mol ) with 2 -hydroxymethyl piperidine 2.10g (0.018 mol ) in same way as the synthetic method of compound 1 it reacted, treated and 3.01 g (yield 79% ) acquired the compound 31 of white crystal .

melting point :176~178 deg C

If above-mentioned Production Example 1~4 is referred, compound which is shown in Table 1 ~12 below can be produced.

[0072]

[Table 1]

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
1	1	Ph	H	H	169-171
2	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	126-128
3	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	203-205
4	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	134-136
5	1	2-F-Ph	H	H	
6	1	3-F-Ph	H	H	
7	1	4-F-Ph	H	H	134-136
8	1	2-Cl-Ph	H	H	
9	1	3-Cl-Ph	H	H	182-184
10	1	4-Cl-Ph	H	H	150-155
11	1	2-Br-Ph	H	H	
12	1	3-Br-Ph	H	H	
13	1	4-Br-Ph	H	H	
14	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
15	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	95-97
16	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	

【表 2】

[Table 2]

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
17	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
18	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	148-151
19	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	148-151
20	1	4-tBu-Ph	H	H	
21	1	2-OPh-Ph	H	H	
22	1	3-OPh-Ph	H	H	
23	1	4-OPh-Ph	H	H	
24	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
25	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
26	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
27	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	H	
28	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	H	
29	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
30	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
31	1	$\alpha$ -Naph	H	H	176-178
32	1	$\beta$ -Naph	H	H	
33	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	H	

【0073】

【表 3】

[0073]

[Table 3]



化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
34	2	Ph	H	H	
35	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
36	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
37	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
38	2	2-F-Ph	H	H	
39	2	3-F-Ph	H	H	
40	2	4-F-Ph	H	H	
41	2	2-Cl-Ph	H	H	
42	2	3-Cl-Ph	H	H	188-190
43	2	4-Cl-Ph	H	H	86-89
44	2	2-Br-Ph	H	H	
45	2	3-Br-Ph	H	H	
46	2	4-Br-Ph	H	H	
47	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
48	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	89-92
49	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	

【表 4】

[Table 4]

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
50	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
51	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
52	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
53	2	4-tBu-Ph	H	H	
54	2	2-OPh-Ph	H	H	
55	2	3-OPh-Ph	H	H	
56	2	4-OPh-Ph	H	H	
57	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
58	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
59	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
60	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	H	
61	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	H	
62	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
63	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
64	2	$\alpha$ -Naph	H	H	
65	2	$\beta$ -Naph	H	H	
66	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	H	

【0074】

【表 5】

[0074]

[Table 5]

化合物	No. n	Ar	R	L	融点 (°C)
67	1	Ph	CH <sub>3</sub>	H	
68	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
69	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
70	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
71	1	2-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
72	1	3-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
73	1	4-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
74	1	2-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
75	1	3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
76	1	4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
77	1	2-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
78	1	3-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
79	1	4-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
80	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
81	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
82	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
83	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
84	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
85	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
86	1	4-tBu-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
87	1	2-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	

【表 6】

[Table 6]

化合物 No. n	Ar	R	L	融点 (°C)
88	1	3-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H
89	1	4-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H
90	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
91	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
92	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
93	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
94	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
95	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
96	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
97	1	$\alpha$ -Naph	CH <sub>3</sub>	H
98	1	$\beta$ -Naph	CH <sub>3</sub>	H
99	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	CH <sub>3</sub>	H

【0075】

[0075]

【表 7】

[Table 7]

化合物 No. n	Ar	R	L	融点 (°C)
100	2	Ph	CH <sub>3</sub>	H
101	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
102	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
103	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
104	2	2-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H
105	2	3-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H
106	2	4-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H
107	2	2-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
108	2	3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
109	2	4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
110	2	2-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
111	2	3-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
112	2	4-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
113	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
114	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
115	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
116	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H

【表 8】

[Table 8]

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
118	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
119	2	4-tBu-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
120	2	2-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
121	2	3-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
122	2	4-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
123	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
124	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
125	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
126	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
127	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
128	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
129	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
130	2	$\alpha$ -Naph	CH <sub>3</sub>	H	
131	2	$\beta$ -Naph	CH <sub>3</sub>	H	
132	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	CH <sub>3</sub>	H	

【0076】

【表 9】

[0076]

[Table 9]

化合物 No. n	Ar	R	L	融点 (°C)
133	1	Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
134	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
135	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
136	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
137	1	2-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
138	1	3-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
139	1	4-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
140	1	2-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
141	1	3-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
142	1	4-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
143	1	2-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
144	1	3-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
145	1	4-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
146	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
147	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
148	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
149	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
150	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>

【表 10】

[Table 10]

化合物 No. n	Ar	R	L	融点 (°C)
152	1	4-tBu-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
153	1	2-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
154	1	3-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
155	1	4-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
156	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
157	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
158	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
159	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
160	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
161	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
162	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>
163	1	$\alpha$ -Naph	H	6-CH <sub>3</sub>
164	1	$\beta$ -Naph	H	6-CH <sub>3</sub>
165	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>

【0077】

[0077]

【表 11】

[Table 11]

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
166	1	Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
167	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
168	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
169	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
170	1	2-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
171	1	3-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
172	1	4-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
173	1	2-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
174	1	3-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
175	1	4-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
176	1	2-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
177	1	3-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
178	1	4-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
179	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
180	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
181	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
182	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
183	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
184	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
185	1	4-tBu-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
186	1	2-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
187	1	3-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	

【表 12】

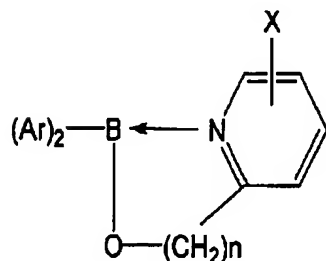
[Table 12]

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
188	1	4-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
189	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
190	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
191	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
192	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
193	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
194	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
195	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
196	1	$\alpha$ -Naph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
197	1	$\beta$ -Naph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
198	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
1100	1	4-Ph-Ph	H	H	
1101	1	4-Ph-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
1102	2	4-Ph-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
1103	1	4-Ph-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
1104	1	4-Ph-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
1105	1	3-Ph-Ph	H	H	
1106	1	3-Ph-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
1107	2	3-Ph-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
1108	1	3-Ph-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
1109	1	3-Ph-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	

【0078】

以下の製造例 5 および 6 は下記式で示される化合物に関する:

【化 27】



製造例 5

化合物 199(式中、n は 1、Ar はフェニル、X は水素)の合成

[0078]

Production Example 5 and 6 below regards compound which is shown with below-mentioned formula:

[Chemical Formula 27]

Production Example 5

Synthesis of compound 199 (In Formula, as for n 1, as for Ar as for phenyl, X hydrogen)



ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル 2.6 g (0.012mol)とエチルエーテル 30 ml および 10% 塩酸水溶液 30ml を漏斗に仕込み、約 15 分間 振り混ぜた後分液し、有機層を 1 回水洗し有機層をナスフラスコに移し替えた。

2-ヒドロキメチルピリジン 1.94g(0.018mol)および エタノール 7ml を加えて室温下で 2 時間攪拌した。

生成した沈殿を濾集し含水アルコールで再結晶し、乾燥して白色結晶の化合物 199 を 2.5g(収率 76%)得た。

融点:150~151 deg C

【0079】

#### 製造例 6

化合物 246(n は 2、Ar は 3-トリフルオロメチル、X は水素)の合成

ジ(3-トリフルオロメチル)-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 2.77g(0.012mol)と 2-ヒドロキシエチルピリジン 2.21g(0.018mol)を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 246 を 3.96g(収率 78%)得た。

融点:140~142 deg C

【0080】

上記製造例 5 および 6 を参考にすれば、以下の表 13~41 中に示される化合物を製造することができる。

【表 13】

diphenylboronic acid ethanolamine ester 2.6 g (0.012 mol ) with you inserted ethyl ether 30 ml and 10% hydrochloric acid solution 30ml in funnel ,approximately 15 min after shaking, separating you did, one time water wash did organic layer and transferred organic layer to round-bottom flask .

2 hours it agitated under room temperature 2 -hydroxymethyl pyridine 1.94g (0.018 mol ) and including the ethanol 7ml .

It filtered precipitation which it forms and recrystallization did with water-containing alcohol , dried and 2.5 g (yield 76% ) acquired compound 199 of white crystal .

melting point :150~151 deg C

[0079]

#### Production Example 6

Synthesis of compound 246 (As for n 2, as for Ar as for 3 -trifluoromethyl , X hydrogen )

di (3 -trifluoromethyl ) -phenylboronic acid ethanolamine ester 2.77g (0.012 mol ) with 2 -hydroxyethyl pyridine 2.21g (0.018 mol ) in same way as the synthetic method of compound 1 it reacted, treated and 3.96 g (yield 78% ) acquired the compound 246 of white crystal .

melting point :140~142 deg C

[0080]

If above-mentioned Production Example 5 and 6 is referred, compound which is shown in Table 13 ~41 below can be produced.

[Table 13]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
199	1	Ph	H	150-151
200	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	188-192
201	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	117-119
202	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	147-149
203	1	2-F-Ph	H	
204	1	3-F-Ph	H	
205	1	4-F-Ph	H	137-139
206	1	2-Cl-Ph	H	
207	1	3-Cl-Ph	H	105-107
208	1	4-Cl-Ph	H	133-134
209	1	2-Br-Ph	H	
210	1	3-Br-Ph	H	
211	1	4-Br-Ph	H	
212	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
213	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	92-94
214	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
215	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	183-185

【表 14】

[Table 14]

化合物 No.	n	Ar	X	熔点 (°C)
216	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
217	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	129-131
218	1	2-OPh-Ph	H	
219	1	3-OPh-Ph	H	
220	1	4-OPh-Ph	H	
221	1	4-tBu-Ph	H	
222	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
223	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
224	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
225	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
226	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
227	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
228	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
229	1	$\alpha$ -Naph	H	233-236
230	1	$\beta$ -Naph	H	
231	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

【0081】

【表 15】

[0081]

[Table 15]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
232	2 Ph	H	176-178
233	2 2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	208-211
234	2 3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
235	2 4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
236	2 2-F-Ph	H	
237	2 3-F-Ph	H	
238	2 4-F-Ph	H	118-120
239	2 2-Cl-Ph	H	
240	2 3-Cl-Ph	H	137-139
241	2 4-Cl-Ph	H	140-142
242	2 2-Br-Ph	H	
243	2 3-Br-Ph	H	
244	2 4-Br-Ph	H	
245	2 2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
246	2 3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	140-142
247	2 4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
248	2 2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	

【表 16】

[Table 16]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
250	2 4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	148-151
251	2 4-tBu-Ph	H	
252	2 2-OPh-Ph	H	
253	2 3-OPh-Ph	H	
254	2 4-OPh-Ph	H	
255	2 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
256	2 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
257	2 2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
258	2 2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
259	2 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
260	2 3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
261	2 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
262	2 $\alpha$ -Naph	H	215-218
263	2 $\beta$ -Naph	H	
264	2 4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

【0082】

[0082]

【表 17】

[Table 17]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
265	1	Ph	2-Cl	
266	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
267	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
268	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
269	1	2-F-Ph	2-Cl	
270	1	3-F-Ph	2-Cl	
271	1	4-F-Ph	2-Cl	
272	1	2-Cl-Ph	2-Cl	
273	1	3-Cl-Ph	2-Cl	
274	1	4-Cl-Ph	2-Cl	
275	1	2-Br-Ph	2-Cl	
276	1	3-Br-Ph	2-Cl	
277	1	4-Br-Ph	2-Cl	
278	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
279	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
280	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
281	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	

【表 18】

[Table 18]

化合物 No.	n	Ar	X	熔点 (°C)
282	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
283	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
284	1	4-tBu-Ph	2-Cl	
285	1	2-OPh-Ph	2-Cl	
286	1	3-OPh-Ph	2-Cl	
287	1	4-OPh-Ph	2-Cl	
288	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
289	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
290	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
291	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-Cl	
292	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-Cl	
293	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
294	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
295	1	$\alpha$ -Naph	2-Cl	
296	1	$\beta$ -Naph	2-Cl	
297	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-Cl	

【0083】

【表 19】

[0083]

[Table 19]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
298	Ph	2-Cl	
299	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
300	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
301	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
302	2-F-Ph	2-Cl	
303	3-F-Ph	2-Cl	
304	4-F-Ph	2-Cl	
305	2-Cl-Ph	2-Cl	
306	3-Cl-Ph	2-Cl	
307	4-Cl-Ph	2-Cl	
308	2-Br-Ph	2-Cl	
309	3-Br-Ph	2-Cl	
310	4-Br-Ph	2-Cl	
311	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
312	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
313	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
314	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	

【表 20】

[Table 20]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
316	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
317	4-tBu-Ph	2-Cl	
318	2-OPh-Ph	2-Cl	
319	3-OPh-Ph	2-Cl	
320	4-OPh-Ph	2-Cl	
321	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
322	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
323	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
324	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-Cl	
325	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-Cl	
326	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
327	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
328	$\alpha$ -Naph	2-Cl	
329	$\beta$ -Naph	2-Cl	
330	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-Cl	

[0084]

[0084]

【表 21】

[Table 21]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
331	1	Ph	3-Cl	
332	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
333	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
334	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
335	1	2-F-Ph	3-Cl	
336	1	3-F-Ph	3-Cl	
337	1	4-F-Ph	3-Cl	
338	1	2-Cl-Ph	3-Cl	
339	1	3-Cl-Ph	3-Cl	
340	1	4-Cl-Ph	3-Cl	
341	1	2-Br-Ph	3-Cl	
342	1	3-Br-Ph	3-Cl	
343	1	4-Br-Ph	3-Cl	
344	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
345	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
346	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
347	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	

【表 22】

[Table 22]



化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
349	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
350	1	2-OPh-Ph	3-Cl	
351	1	4-tBu-Ph	3-Cl	
352	1	3-OPh-Ph	3-Cl	
353	1	4-OPh-Ph	3-Cl	
354	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
355	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
356	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
357	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	3-Cl	
358	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	3-Cl	
359	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
360	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
361	1	$\alpha$ -Naph	3-Cl	
362	1	$\beta$ -Naph	3-Cl	
363	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	3-Cl	

【0085】

【表 23】

[0085]

[Table 23]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
364	2 Ph	3-Cl	
365	2 2-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
366	2 3-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
367	2 4-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
368	2 2-F-Ph	3-Cl	
369	2 3-F-Ph	3-Cl	
370	2 4-F-Ph	3-Cl	
371	2 2-Cl-Ph	3-Cl	
372	2 3-Cl-Ph	3-Cl	
373	2 4-Cl-Ph	3-Cl	
374	2 2-Br-Ph	3-Cl	
375	2 3-Br-Ph	3-Cl	
376	2 4-Br-Ph	3-Cl	
377	2 2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
378	2 3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
379	2 4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
380	2 2-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	

【表 24】

[Table 24]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
382	2 4-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
383	2 4-tBu-Ph	3-Cl	
384	2 2-OPh-Ph	3-Cl	
385	2 3-OPh-Ph	3-Cl	
386	2 4-OPh-Ph	3-Cl	
387	2 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
388	2 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
389	2 2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
390	2 2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	3-Cl	
391	2 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	3-Cl	
392	2 3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
393	2 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
394	2 $\alpha$ -Naph	3-Cl	
395	2 $\beta$ -Naph	3-Cl	
396	2 4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	3-Cl	

【0086】

[0086]

【表 25】

[Table 25]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
397	1	Ph	4-Cl	
398	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
399	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
400	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
401	1	2-F-Ph	4-Cl	
402	1	3-F-Ph	4-Cl	
403	1	4-F-Ph	4-Cl	
404	1	2-Cl-Ph	4-Cl	
405	1	3-Cl-Ph	4-Cl	
406	1	4-Cl-Ph	4-Cl	
407	1	2-Br-Ph	4-Cl	
408	1	3-Br-Ph	4-Cl	
409	1	4-Br-Ph	4-Cl	
410	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
411	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
412	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
413	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	

【表 26】

[Table 26]

化合物 No. n	Ar	X	熔点 (°C)
415	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl
416	1	4-tBu-Ph	4-Cl
417	1	2-OPh-Ph	4-Cl
418	1	3-OPh-Ph	4-Cl
419	1	4-OPh-Ph	4-Cl
420	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl
421	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl
422	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl
423	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-Cl
424	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-Cl
425	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl
426	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl
427	1	$\alpha$ -Naph	4-Cl
428	1	$\beta$ -Naph	4-Cl
429	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-Cl

【0087】

【表 27】

[0087]

[Table 27]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
430	2	Ph	4-Cl	
431	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
432	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
433	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
434	2	2-F-Ph	4-Cl	
435	2	3-F-Ph	4-Cl	
436	2	4-F-Ph	4-Cl	
437	2	2-Cl-Ph	4-Cl	
438	2	3-Cl-Ph	4-Cl	
439	2	4-Cl-Ph	4-Cl	
440	2	2-Br-Ph	4-Cl	
441	2	3-Br-Ph	4-Cl	
442	2	4-Br-Ph	4-Cl	
443	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
444	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
445	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
446	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	

【表 28】

[Table 28]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
447	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
448	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
449	2	4-tBu-Ph	4-Cl	
450	2	2-OPh-Ph	4-Cl	
451	2	3-OPh-Ph	4-Cl	
452	2	4-OPh-Ph	4-Cl	
453	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
454	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
455	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
456	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-Cl	
457	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-Cl	
458	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
459	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
460	2	$\alpha$ -Naph	4-Cl	
461	2	$\beta$ -Naph	4-Cl	
462	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-Cl	

【0088】

【表 29】

[0088]

[Table 29]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
463	Ph	4-CF <sub>3</sub>	
464	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
465	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
466	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
467	2-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
468	3-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
469	4-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
470	2-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
471	3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
472	4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
473	2-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
474	3-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
475	4-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
476	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
477	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
478	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
479	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	

【表 30】

[Table 30]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
481	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
482	4-tBu-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
483	2-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
484	3-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
485	4-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
486	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
487	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
488	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
489	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
490	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
491	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
492	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
493	$\alpha$ -Naph	4-CF <sub>3</sub>	
494	$\beta$ -Naph	4-CF <sub>3</sub>	
495	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-CF <sub>3</sub>	

[0089]

[0089]

【表 31】

[Table 31]

化合物 No.	n	Ar	X	熔点 (°C)
496	2	Ph	4-CF <sub>3</sub>	
497	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
498	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
499	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
500	2	2-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
501	2	3-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
502	2	4-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
503	2	2-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
504	2	3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
505	2	4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
506	2	2-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
507	2	3-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
508	2	4-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
509	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
510	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
511	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
512	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	

【表 32】

[Table 32]



化合物 No.	n	Ar	X	熔点 (°C)
513	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
514	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
515	2	4-tBu-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
516	2	2-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
517	2	3-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
518	2	4-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
519	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
520	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
521	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
522	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
523	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
524	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
525	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
526	2	$\alpha$ -Naph	4-CF <sub>3</sub>	
527	2	$\beta$ -Naph	4-CF <sub>3</sub>	
528	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-CF <sub>3</sub>	

【0090】

【表 33】

[0090]

[Table 33]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
529	Ph	5-CF <sub>3</sub>	
530	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
531	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
532	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
533	2-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
534	3-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
535	4-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
536	2-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
537	3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
538	4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
539	2-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
540	3-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
541	4-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
542	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
543	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
544	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
545	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	

【表 34】

[Table 34]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
547	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
548	4-tBu-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
549	2-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
550	3-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
551	4-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
552	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
553	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
554	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
555	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
556	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
557	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
558	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
559	$\alpha$ -Naph	5-CF <sub>3</sub>	
560	$\beta$ -Naph	5-CF <sub>3</sub>	
561	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-CF <sub>3</sub>	

[0091]

[0091]

【表 35】

[Table 35]

化合物	No. n	Ar	X	熔点 (°C)
562	2	Ph	5-CF <sub>3</sub>	
563	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
564	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
565	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
566	2	2-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
567	2	3-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
568	2	4-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
569	2	2-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
570	2	3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
571	2	4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
572	2	2-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
573	2	3-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
574	2	4-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
575	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
576	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
577	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
578	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	

【表 36】

[Table 36]

化合物	No. n	Ar	X	熔点 (°C)
580	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
581	2	4-tBu-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
582	2	2-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
583	2	3-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
584	2	4-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
585	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
586	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
587	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
588	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
589	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
590	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
591	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
592	2	$\alpha$ -Naph	5-CF <sub>3</sub>	
593	2	$\beta$ -Naph	5-CF <sub>3</sub>	
594	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-CF <sub>3</sub>	

【0092】

【表 37】

[0092]

[Table 37]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
628	1	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
629	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
630	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
631	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
632	1	2-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
633	1	3-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
634	1	4-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
635	1	2-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
636	1	3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
637	1	4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
638	1	2-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
639	1	3-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
640	1	4-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
641	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
642	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
643	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
644	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>

【表 38】

[Table 38]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
646	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
647	1	4-tBu-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
648	1	2-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
649	1	3-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
650	1	4-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
651	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
652	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
653	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
654	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
655	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
656	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
657	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
658	1	$\alpha$ -Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>
659	1	$\beta$ -Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>
660	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>

【0093】

[0093]

【表 39】

[Table 39]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
661	2	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
662	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
663	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
664	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
665	2	2-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
666	2	3-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
667	2	4-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
668	2	2-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
669	2	3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
670	2	4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
671	2	2-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
672	2	3-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
673	2	4-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
674	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
675	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
676	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
677	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

【表 40】

[Table 40]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
879	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
880	2	4-tBu-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
881	2	2-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
882	2	3-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
883	2	4-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
884	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
885	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
886	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
887	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
888	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
889	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
890	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
891	2	$\alpha$ -Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
892	2	$\beta$ -Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
893	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

【表 41】

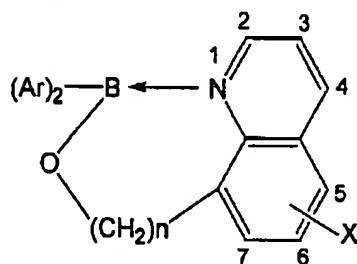
[Table 41]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
1110	1	4-Ph-Ph	H	
1111	2	4-Ph-Ph	H	
1112	1	4-Ph-Ph	2-Cl	
1113	2	4-Ph-Ph	2-Cl	
1114	1	4-Ph-Ph	4-Cl	
1115	2	4-Ph-Ph	4-Cl	
1118	1	4-Ph-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
1117	2	4-Ph-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
1118	1	4-Ph-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1119	2	4-Ph-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1120	1	3-Ph-Ph	H	
1122	2	3-Ph-Ph	H	
1122	1	3-Ph-Ph	2-Cl	
1123	2	3-Ph-Ph	2-Cl	
1124	1	3-Ph-Ph	4-Cl	
1125	2	3-Ph-Ph	4-Cl	
1126	1	3-Ph-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
1127	2	3-Ph-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
1128	1	3-Ph-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1129	2	3-Ph-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

【0094】

以下の製造例 7~9 は下記式で示される化合物に関する:

【化 28】



## 製造例 7

化合物 697(式中、n は 0、Ar は 4-メチルフェニル、X は水素)の合成

ジ(4-メチル)-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 3.04g (0.012mol)と 8-オキシキノリン 2.61g (0.018mol)を化合物 1 の合成法と同様に

【0094】

Production Example 7~9 below regards compound which is shown with below-mentioned formula:

[Chemical Formula 28]

## Production Example 7

Synthesis of compound 697 (In Formula, as for n 0, as for Ar as for 4-methylphenyl, X hydrogen)

di (4-methyl)-phenylboronic acid ethanolamine ester 3.04g (0.012 mol) with 8-oxy quinoline 2.61g (0.018 mol) in same way as the synthetic method of compound 1 it reacted, treated



反応、処理し白色結晶の化合物 697 を 3.28g(収率 81%)得た。

融点:203~205 deg C

#### 製造例 8

化合物 708(式中、n は 0、Ar は 3-トリフルオロメチルフェニル、X は水素)の合成

ジ(3-トリフルオロメチル)-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 2.77g(0.012mol)と 8-オキシキノリン 2.61g(0.018mol)を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 708 を 4.31g(収率 80.8%)得た。

融点:130~132 deg C

#### 製造例 9

化合物 724(式中、n は 0、Ar は  $\alpha$ -ナフチル、X は水素)の合成

ジ- $\alpha$ -ナフチルボロン酸エタノールアミンエステル 3.90g(0.012mol) と 8-オキシキノリン 2.61g(0.018mol)を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 724 を 4.11g(収率 86.3%)得た。

融点:225~226 deg C

【0095】

上記製造例 7~9 を参考にすれば、以下の表 42~66 中に示される化合物を製することができる。

【表 42】

and 3.28 g (yield 81% ) acquired the compound 697 of white crystal .

melting point :203~205 deg C

#### Production Example 8

Synthesis of compound 708 (In Formula, as for n 0, as for Ar as for 3 -trifluoromethyl phenyl , X hydrogen )

di (3 -trifluoromethyl ) -phenylboronic acid ethanolamine ester 2.77g (0.012 mol ) with 8 -oxy quinoline 2.61g (0.018 mol ) in same way as the synthetic method of compound 1 it reacted, treated and 4.31 g (yield 80.8% ) acquired the compound 708 of white crystal .

melting point :130~132 deg C

#### Production Example 9

Synthesis of compound 724 (In Formula, as for n 0, as for Ar;al as for -naphthyl , X hydrogen )

di- ;al -naphthyl boronic acid ethanolamine ester 3.90g (0.012 mol ) with 8 -oxy quinoline 2.61g (0.018 mol ) in same way as the synthetic method of compound 1 it reacted, treated and 4.11 g (yield 86.3% ) acquired the compound 724 of white crystal .

melting point :225~226 deg C

[0095]

If above-mentioned Production Example 7~9 is referred, compound which is shown in Table 4 2~66 below make is possible.

[Table 42]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
694	0	Ph	H	206-207
695	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	189-191
696	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	165-167
697	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	203-205
698	0	2-F-Ph	H	
699	0	3-F-Ph	H	
700	0	4-F-Ph	H	167-169
701	0	2-Cl-Ph	H	
702	0	3-Cl-Ph	H	
703	0	4-Cl-Ph	H	181-182
704	0	2-Br-Ph	H	
705	0	3-Br-Ph	H	
706	0	4-Br-Ph	H	
707	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
708	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	130-132
709	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
710	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	199-200

【表 43】

[Table 43]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
711	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
712	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	212-214
713	0	4-tBu-Ph	H	
714	0	2-OPh-Ph	H	
715	0	3-OPh-Ph	H	
716	0	4-OPh-Ph	H	
717	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
718	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
719	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
720	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
721	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
722	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
723	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
724	0	$\alpha$ -Naph	H	225-226
725	0	$\beta$ -Naph	H	
726	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

【0096】

【表 44】

[0096]

[Table 44]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
727	1	Ph	H	
728	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
729	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
730	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
731	1	2-F-Ph	H	
732	1	3-F-Ph	H	
733	1	4-F-Ph	H	
734	1	2-Cl-Ph	H	
735	1	3-Cl-Ph	H	
736	1	4-Cl-Ph	H	
737	1	2-Br-Ph	H	
738	1	3-Br-Ph	H	
739	1	4-Br-Ph	H	
740	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
741	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
742	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
743	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
744	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	

【表 45】

[Table 45]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
745	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
746	1	4-tBu-Ph	H	
747	1	2-OPh-Ph	H	
748	1	3-OPh-Ph	H	
749	1	4-OPh-Ph	H	
750	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
751	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
752	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
753	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
754	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
755	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
756	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
757	1	$\alpha$ -Naph	H	
758	1	$\beta$ -Naph	H	
759	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

[0097]

[0097]

【表 46】

[Table 46]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
760	0	Ph	5-Cl	
761	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
762	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
763	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
764	0	2-F-Ph	5-Cl	
765	0	3-F-Ph	5-Cl	
766	0	4-F-Ph	5-Cl	
767	0	2-Cl-Ph	5-Cl	
768	0	3-Cl-Ph	5-Cl	
769	0	4-Cl-Ph	5-Cl	
770	0	2-Br-Ph	5-Cl	
771	0	3-Br-Ph	5-Cl	
772	0	4-Br-Ph	5-Cl	
773	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
774	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
775	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
776	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
777	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	

【表 47】

[Table 47]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
778	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl
779	0	4-tBu-Ph	5-Cl
780	0	2-OPh-Ph	5-Cl
781	0	3-OPh-Ph	5-Cl
782	0	4-OPh-Ph	5-Cl
783	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl
784	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl
785	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl
786	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-Cl
787	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-Cl
788	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl
789	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl
790	0	$\alpha$ -Naph	5-Cl
791	0	$\beta$ -Naph	5-Cl
792	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-Cl

【0098】

【表 48】

[0098]

[Table 48]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
793	Ph	5-Cl	
794	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
795	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
796	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
797	2-F-Ph	5-Cl	
798	3-F-Ph	5-Cl	
799	4-F-Ph	5-Cl	
800	2-Cl-Ph	5-Cl	
801	3-Cl-Ph	5-Cl	
802	4-Cl-Ph	5-Cl	
803	2-Br-Ph	5-Cl	
804	3-Br-Ph	5-Cl	
805	4-Br-Ph	5-Cl	
806	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
807	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
808	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
809	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
810	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	

【表 49】

[Table 49]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
811	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
812	4-tBu-Ph	5-Cl	
813	2-OPh-Ph	5-Cl	
814	3-OPh-Ph	5-Cl	
815	4-OPh-Ph	5-Cl	
816	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
817	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
818	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
819	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-Cl	
820	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-Cl	
821	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
822	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
823	$\alpha$ -Naph	5-Cl	
824	$\beta$ -Naph	5-Cl	
825	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-Cl	

【0099】

[0099]

【表 50】

[Table 50]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
826	0	Ph	7-Cl	
827	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
828	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
829	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
830	0	2-F-Ph	7-Cl	
831	0	3-F-Ph	7-Cl	
832	0	4-F-Ph	7-Cl	
833	0	2-Cl-Ph	7-Cl	
834	0	3-Cl-Ph	7-Cl	
835	0	4-Cl-Ph	7-Cl	
836	0	2-Br-Ph	7-Cl	
837	0	3-Br-Ph	7-Cl	
838	0	4-Br-Ph	7-Cl	
839	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
840	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
841	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
842	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
843	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	

【表 51】

[Table 51]



化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
844	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
845	0	4-tBu-Ph	7-Cl	
846	0	2-OPh-Ph	7-Cl	
847	0	3-OPh-Ph	7-Cl	
848	0	4-OPh-Ph	7-Cl	
849	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
850	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
851	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
852	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	7-Cl	
853	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	7-Cl	
854	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
855	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
856	0	$\alpha$ -Naph	7-Cl	
857	0	$\beta$ -Naph	7-Cl	
858	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	7-Cl	

【0100】

【表 52】

[0100]

[Table 52]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
859	Ph	7-Cl	
860	2-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
861	3-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
862	4-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
863	2-F-Ph	7-Cl	
864	3-F-Ph	7-Cl	
865	4-F-Ph	7-Cl	
866	2-Cl-Ph	7-Cl	
867	3-Cl-Ph	7-Cl	
868	4-Cl-Ph	7-Cl	
869	2-Br-Ph	7-Cl	
870	3-Br-Ph	7-Cl	
871	4-Br-Ph	7-Cl	
872	2-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
873	3-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
874	4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
875	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
876	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	

【表 53】

[Table 53]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
877	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
878	4-tBu-Ph	7-Cl	
879	2-OPh-Ph	7-Cl	
880	3-OPh-Ph	7-Cl	
881	4-OPh-Ph	7-Cl	
882	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
883	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
884	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
885	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	7-Cl	
886	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	7-Cl	
887	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
888	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
889	$\alpha$ -Naph	7-Cl	
890	$\beta$ -Naph	7-Cl	
891	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	7-Cl	

【0101】

[0101]

【表 54】

[Table 54]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
892	0	Ph	2-CH <sub>3</sub>	
893	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
894	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
895	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
896	0	2-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
897	0	3-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
898	0	4-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
899	0	2-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
900	0	3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
901	0	4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
902	0	2-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
903	0	3-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
904	0	4-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
905	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
906	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
907	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
908	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
909	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	

【表 55】

[Table 55]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
910	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
911	0	4-tBu-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
912	0	2-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
913	0	3-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
914	0	4-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
915	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
916	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
917	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
918	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
919	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
920	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
921	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
922	0	$\alpha$ -Naph	2-CH <sub>3</sub>	
923	0	$\beta$ -Naph	2-CH <sub>3</sub>	
924	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-CH <sub>3</sub>	

【0102】

【表 56】

[0102]

[Table 56]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
925	Ph	2-CH <sub>3</sub>	
926	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
927	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
928	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
929	2-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
930	3-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
931	4-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
932	2-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
933	3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
934	4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
935	2-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
936	3-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
937	4-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
938	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
939	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
940	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
941	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
942	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	

【表 57】

[Table 57]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
943	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
944	4-tBu-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
945	2-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
946	3-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
947	4-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
948	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
949	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
950	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
951	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
952	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
953	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
954	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
955	$\alpha$ -Naph	2-CH <sub>3</sub>	
956	$\beta$ -Naph	2-CH <sub>3</sub>	
957	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-CH <sub>3</sub>	

【表 58】

[Table 58]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
958	0	Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
959	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
960	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
961	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
962	0	2-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
963	0	3-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
964	0	4-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
965	0	2-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
966	0	3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
967	0	4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
968	0	2-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
969	0	3-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
970	0	4-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
971	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
972	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
973	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
974	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
975	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

【表 59】

[Table 59]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
976	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
977	0	4-tBu-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
978	0	2-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
979	0	3-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
980	0	4-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
981	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
982	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
983	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
984	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
985	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
986	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
987	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
988	0	$\alpha$ -Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
989	0	$\beta$ -Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
990	0	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

【表 60】

[Table 60]

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
991	0	Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
992	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
993	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
994	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
995	0	2-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
996	0	3-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
997	0	4-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
998	0	2-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
999	0	3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1000	0	4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1001	0	2-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1002	0	3-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1003	0	4-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1004	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1005	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1006	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1007	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1008	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

【表 61】

[Table 61]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
1009	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1010	0	4-tBu-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1011	0	2-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1012	0	3-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1013	0	4-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1014	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1015	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1016	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1017	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1018	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1019	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1020	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1021	0	$\alpha$ -Naph	5-SO <sub>3</sub> H
1022	0	$\beta$ -Naph	5-SO <sub>3</sub> H
1023	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-SO <sub>3</sub> H

【表 62】

[Table 62]



化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
1024	Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1025	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1026	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1027	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1028	2-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1029	3-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1030	4-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1031	2-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1032	3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1033	4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1034	2-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1035	3-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1036	4-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1037	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1038	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1039	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1040	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1041	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

【表 63】

[Table 63]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
1042	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1043	4-tBu-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1044	2-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1045	3-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1046	4-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1047	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1048	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1049	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1050	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1051	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1052	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1053	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1054	$\alpha$ -Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1055	$\beta$ -Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1056	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

【表 64】

[Table 64]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
1057	1	Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1058	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1059	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1060	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1061	1	2-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1062	1	3-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1063	1	4-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1064	1	2-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1065	1	3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1066	1	4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1067	1	2-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1068	1	3-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1069	1	4-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1070	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1071	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1072	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1073	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1074	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

【表 65】

[Table 65]

化合物	No. n	Ar	X	融点 (°C)
1075	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1076	1	4-tBu-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1077	1	2-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1078	1	3-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1079	1	4-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1080	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1081	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1082	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1083	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1084	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1085	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1086	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1087	1	$\alpha$ -Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1088	1	$\beta$ -Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1089	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

【表 66】

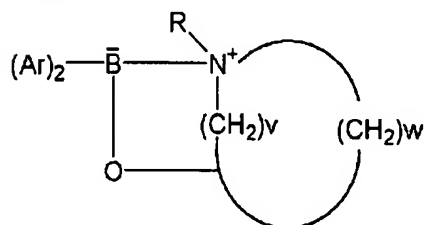
[Table 66]

化合物 No. n	Ar	X	融点 (°C)
1130	0	4-Ph-Ph	H
1131	1	4-Ph-Ph	H
1132	0	4-Ph-Ph	5-Cl
1133	1	4-Ph-Ph	5-Cl
1134	0	4-Ph-Ph	2-CH <sub>3</sub>
1135	2	4-Ph-Ph	2-CH <sub>3</sub>
1138	0	4-Ph-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1137	0	4-Ph-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>
1138	1	4-Ph-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>
1139	1	4-Ph-Ph	7-Cl
1140	0	3-Ph-Ph	H
1141	1	3-Ph-Ph	H
1142	0	3-Ph-Ph	5-Cl
1143	1	3-Ph-Ph	5-Cl
1144	0	3-Ph-Ph	2-CH <sub>3</sub>
1145	2	3-Ph-Ph	2-CH <sub>3</sub>
1146	0	3-Ph-Ph	5-SO <sub>3</sub> H
1147	0	3-Ph-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>
1148	1	3-Ph-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>
1149	1	3-Ph-Ph	7-Cl

【0103】

以下の製造例 10 は下記式で示される化合物に関する:

【化 29】



(式中、v および w は各々独立して 1~3 の整数である)

製造例 10

製造例 1-4 と同様の手法に従い、化合物 1150 を得た。

融点:204-208 deg C

[0103]

Production Example 10 below regards compound which is shown with below-mentioned formula:

[Chemical Formula 29]

(In Formula, v and w independently, is integer 1 - 3. )

Production Example 10

compound 1150 was acquired in accordance with technique which is similar to Production Example 1- 4.

melting point :204-208 deg C

上記製造例 1-4 を参考にすれば、以下の表 67  
中に示される化合物を製することができる。

If above-mentioned Production Example 1- 4 is referred,  
compound which is shown in Table 6 7 below make is  
possible.

【0104】

[0104]

【表 67】

[Table 67]

化合物 No.	v	w	Ar	R	融点 (°C)
1150	2	2	4-Cl-Ph	H	204-208
1151	1	3	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	174-178
1152	2	2	4-Ph-Ph	H	
1153	1	3	4-Ph-Ph	H	
1154	2	2	3-Ph-Ph	H	
1155	1	3	3-Ph-Ph	H	

【0105】

[0105]

以下、本発明殺線虫剤の製剤例を説明する。

Below, Formulation Example of this invention nematocide is  
explained.

実施例 1

Working Example 1

化合物(I)													5部
compound (I)													5 sections
β -オキシ-エチルフェニルエーテル													5部
β -oxy - ethyl phenyl ether													5 sections
ゼオライト													90部
zeolite													90 sections

化合物(I)をβ -オキシ-エチルフェニルエーテル  
に溶解させ、ゼオライトに噴霧混合し、乾燥させ  
て微粒剤を得る。

Melting compound (I) in the β -oxy -ethyl phenyl ether ,  
atomization it mixes to the zeolite , dries and obtains fine  
granule .

【0106】

[0106]

実施例 2

Working Example 2

	化合物(I)
	compound (I)
ベントナイト粉末	40部
bentonite powder	40 sections
リグニンスルホン酸Na	2部

lignin sulfonic acid na		2 sections
タルク		53部
talc		53 sections

し造粒機で造粒・乾燥して粒剤を得る。

It does and granulating \* dries with granulator and obtains granule .

【0107】

[0107]

試験例

Test Example

以下に示す試験例により、本発明に係る化合物の植物用殺線虫活性を証明した。

nematocidal activity for plant of compound which relates to this invention with Test Example which is shown below, was proven.

試験例 1 自活性線虫 *Caenorhabditis elegans* を用いた殺線虫活性の評価

evaluation of nematocidal activity which uses Test Example 1 our actinic radiation insect *Caenorhabditis elegans*

供試化合物として以下の表 68 に示す化合物、および対照化合物としてメチル・イソチオシアネート(MITC)を、無菌継代培養(Sayer et., al, 1963)中の個体群より III 期幼虫を選択した *Caenorhabditis elegans* N2 に供し、その殺線虫活性を試験した。

methyl \* isothiocyanate (MITC ), was offered to *Caenorhabditis elegans* N2 which selects III period larva from solid group in sterile subculturing (Sayer et., al, 1963 ) as compound , and control compound which are shown in Table 6 8 below as test compound , nematocidal activity was tested.

供試化合物および対照化合物を DMSO に加えて 1%溶液とした。

It made 1% solution test compound and control compound in addition to DMSO .

これに Tween20 を 100ppm 含む M-9 緩衝液(Brenner, Genetics, 77, 71-94, 1974)を加えることで、各化合物濃度が 500ppm の試験液を調製した。

By fact that M-9buffer (Brenner, genetics , 77, 71-94, 1974 ) which Tween20 100 ppm is included is added, each compound concentration manufactured test liquid of 500 ppm in this.

3 孔ホールスライドグラス(孔径 15 mm、深さ 1 mm)の 1 孔に 40  $\mu$ l の M-9 緩衝液を入れ、この中に 10 頭の線虫を移植針にて移した後、500ppm の上記試験液 40  $\mu$ l を加えて軽く攪拌し、最終濃度を 250ppm とした。

You inserted M-9buffer of 40;mu l in 1 hole of 3 hole glass slide (hole diameter 15 mm , depth 1 mm ),after in this moving nematode of 10 heads with transplant needle , you agitated lightly including above-mentioned test liquid 40;mu l of 500 ppm , designated final concentration as 250 ppm .

スライドグラスを湿室にいれ、約 22 deg C に保ち 24 および 48 時間後に生存虫数を調べた。

You inserted glass slide in humid room , maintained at approximately 22 deg C and inspected number of surviving insects 24 and 48 hours later.

なお、1 処理に対して反復を 3 とし、対照剤の最終濃度は 250ppm とした。

Furthermore, repetition was designated as 3 vis-a-vis 1 treatment, the final concentration of control agent made 250 ppm .

2 次評価試験は、125ppm から始めて 4 倍希釈で行った。

secondary test from 125 ppm 4 -fold did for first time with dilution.

試験方法は上記 1 次評価試験に準じた。

test method corresponded to above-mentioned primary test .

【0108】

[0108]

表 68 に 1 次評価試験の結果を示す。

Result of primary test is shown in Table 6 8.

結果は、無処理群の死虫率を 0%として換算した補正死虫率として表している。

化合物 1、232、3、4、202、19、250、208、241、10、7、238、9 および 42 が 100%死亡率を示した。

なお、その内化合物 19 および 208 を除き、いずれも 24 時間以内に死亡させた。

表 69 に 2 次評価試験の結果を示す。

化合物 4、202、208、241 および 10 が 32ppm まで 90%以上の活性を示した。

#### 【表 68】

1 次評価試験における *C. elegans* III 期幼虫に対する活性

化合物番号	補正死虫率
1	100*
2 3 2	100*
3	100*
4	100*
2 0 2	100*
1 9	100
2 5 0	100*
2 0 8	100
2 4 1	100*
1 0	100*
1 5	89.1
2 4 6	94.3
7	100*
2 3 8	100*
9	100*
4 2	100*
2 4 0	97.3
MITC	100

\*24 時間以内に死亡

【0109】

#### 【表 69】

2 次評価試験における *C. elegans* III 期幼虫に対する活性

0% doing insect mortality of untreated group, you display result, as the correction insect mortality which it converts.

compound 1, 2 32, 3, 4, 2 02, 1 9, 2 50, 208, 241, 10, 7, 238, 9 and 42 showed 100% mortality.

Furthermore, death it did in each case within 24 hours compound 19 among those and excluding 208.

Result of secondary test is shown in Table 6 9.

compound 4, 2 02, 2 08, 2 41 and 10 showed activity of 90% or more to 32 ppm.

#### [Table 68]

activity for *C. elegans* III period larva in primary test

\* Within 24 hours death

[0109]

#### [Table 69]

activity for *C. elegans* III period larva in secondary test

## 対する活性

化合物番号	補正死虫率	
	31.25 (ppm)	125 (ppm)
1	74.3	100
2 3 2	38.5	100
3	76.5	100
4	100	100
2 0 2	96.8	100
1 9	50.4	100
2 5 0	67.9	100
2 0 8	100	100
2 4 1	93.9	100
1 0	100	100
7	32.4	97.0
2 3 8	55.0	100
9	76.4	100
4 2	80.7	100
2 4 0	48.6	100

## 【0110】

## 試験例 2 サツマイモネコブセンチュウを用いた殺線虫活性の評価

供試化合物として以下の表 70 に示す化合物および対照化合物としてメチル・イソチオシアネート(MITC)を、サツマイモ(高系 14 号)の根より採集した卵囊より 24 時間以内に孵化した第 II 期幼虫のサツマイモネコブセンチュウ *Meloidogyne incognita* に供し、その殺線虫活性を試験した。

試験化合物および対照化合物を DMSO に加え、1%溶液とした。

この DMSO 溶液 25  $\mu$ l を、Tween20 を 100ppm 含む精製水 975  $\mu$ l に加えることで、各化合物濃度が 250ppm の試験液 1ml を調製した。

毛细管ピペットを用いてサツマイモネコブセンチュウ第 II 期幼虫を 20 頭吸い取り、約 10ml 容のスピッツグラスに入れた(水量は 20  $\mu$ l)。

## 【0110】

evaluation of nematocidal activity which uses southern root-knot nematode Test Example 2 *Meloidogyne incognita* [Kofoid et White] Chitwood

It offered to southern root-knot nematode *Meloidogyne incognita*, tested nematocidal activity . *Meloidogyne incognita* [Kofoid et White] Chitwood of Group I I period larva which is hatched within 24 hours than cocoon which collects methyl \* isothiocyanate (MITC), from root of *Ipomoea batatas* Lam. (Sweet potato) (High system 14) as compound and control compound which are shown in the Table 70 below as test compound

test compound and control compound in addition to DMSO, it made 1% solution.

this DMSO solution 25  $\mu$ l, by fact that it adds to purified water 975  $\mu$ l which Tween20 100 ppm is included, each compound concentration manufactured the test liquid 1ml of 250 ppm.

20 it sucked up southern root-knot nematode Group I I period larva, inserted in [supittsugurasu] of approximately 10 ml capacity (As for water amount 20  $\mu$ l). Making use of



試験液 1ml とセンチュウ(水量 20  $\mu$ l)を軽く攪拌後、25 deg C に保った。

48 時間後に遠心機を用いて線虫を 3 回洗浄した(1500 r.p.m.)後、厚さ 1mm のフェルトをろ過材としたミニベールマン装置に線虫を移し、25 deg C、48 時間以内に分離されてくる個体を生と判別して死虫率を求めた。

結果は補正死虫率として表した。

【0111】

得られた結果を表 70 に示した。

化合物 238 が 100%、241 および 10 が 90%付近の死虫率を示した。

【0112】

【表 70】

サツマイモネコブセンチュウに対する活性

No.	化合物番号	補正死虫率
9	2 4 1	94.0
11	1 0	88.1
13	2 3 8	100
19	MITC	100
20	未処理	0

【0113】

【発明の効果】

上記した有機ホウ素化合物を有効成分とする本発明の組成物は、上記試験例から明らかなように、植物寄生性線虫を死滅させる強い殺線虫作用を有している。

本発明殺線虫剤は線虫病を防除できるため、各種農産物の収穫高を向上させることができる。

capillary pipette *Meliodogyne incongnita* [Kofoid et White] Chitwood

test liquid 1ml and nematode (water amount 20;  $\mu$ l) were maintained lightly at after stirring, 25 deg C.

After (1500 rpm) which nematode thrice was washed, it moved nematode to [minibeeruman] equipment which designates felt of thickness 1mm as filter material 48 hours later making use of centrifuge, distinguishing solid which is separated within 25 deg C, 48 hours with raw, it sought insect mortality.

As for result you displayed as correction insect mortality.

【0111】

Result which it acquires was shown in Table 70.

compound 238 100%, 241 and 10 insect mortality of 90% vicinity was shown.

【0112】

【Table 70】

activity for southern root-knot nematode *Meliodogyne incongnita* [Kofoid et White] Chitwood

【0113】

[Effects of the Invention]

It has possessed strong nematocidal action where as been clear from the above-mentioned Test Example, plant parasitic nematode extermination it does composition of the this invention which designates organoboron compound which you inscribed as active ingredient.

Because nematode disease can be prevented, yield quantity of various agricultural product it can improve this invention nematocidal.